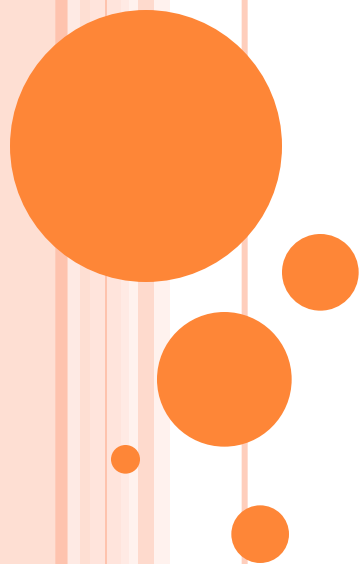


# ОСНОВНЫЕ КЛАССИФИКАЦИИ И ПОНЯТИЯ ТЕХНОЛОГИИ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ



# ТЕХНОЛОГИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ – ЭТО ЧАСТЬ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЙ ТЕХНОЛОГИИ

Технология лекарственных форм — это наука о теоретических основах и производственных процессах переработки лекарственных средств в лекарственные препараты путем придания им определенной лекарственной формы на основании установленных физических, химических, механических и других закономерностей.



# ОСНОВНЫЕ ЗАДАЧИ ТЕХНОЛОГИИ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ

- разработка теоретических обоснований и поиск путей интенсификации существующих методов изготовления лекарственных форм;
- создание новых способов изготовления лекарственных форм на основании использования современных достижений смежных наук и совершенствование старых способов;
- разработка технологических основ и методов производства новых лекарственных субстанций и препаратов, в которых максимально проявляется лечебный эффект, минимально побочное действие и которые удобны при использовании больными;
- поиск, изучение и использование в производстве лекарств новых вспомогательных веществ;
- изучение эффективности технологического процесса, основными показателями которого являются:
  - удельный расход сырья,
  - энерго- и трудозатраты на единицу продукции;
  - выход и качество готовой продукции;
  - интенсивность процесса;
  - себестоимость продукции.

# ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ СРЕДСТВО

- **Фармакологическое средство** — это вещество или смесь веществ с установленной фармакологической активностью.
- После получения положительных результатов клинических испытаний и разрешения уполномоченного на то органа к медицинскому применению оно получает название лекарственного средства.

# Лекарственные средства

- Для целей настоящего Федерального закона об обороте лекарственных средств используются следующие основные понятия:
- **Лекарственные средства** - вещества или их комбинации, вступающие в контакт с организмом человека или животного, проникающие в органы, ткани организма человека или животного, **применяемые для профилактики, диагностики** (за исключением веществ или их комбинаций, не контактирующих с организмом человека или животного), **лечения заболевания, реабилитации, для сохранения, предотвращения или прерывания беременности** и **полученные из крови, плазмы крови, из органов, тканей организма человека или животного, растений, минералов методами синтеза или с применением биологических технологий.**
- К лекарственным средствам относятся **фармацевтические субстанции и лекарственные препараты;**



## ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СУБСТАНЦИИ

- ▣ **Фармацевтические субстанции** - лекарственные средства в виде действующих веществ биологического, биотехнологического, минерального или химического происхождения, **обладающие фармакологической активностью**, предназначенные для производства, изготовления лекарственных препаратов и определяющие их эффективность

## Лекарственные препараты

- ▣ **Лекарственные препараты** - лекарственные средства **в виде лекарственных форм**, применяемые для профилактики, диагностики, лечения заболевания, реабилитации, для сохранения, предотвращения или прерывания беременности;



## ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

- ▣ **Лекарственная форма** — состояние лекарственного препарата, соответствующее способам его введения и применения и обеспечивающее достижение необходимого лечебного эффекта;

## Вспомогательное вещество

- ▣ **Вспомогательные вещества** - вещества неорганического или органического происхождения, используемые в процессе производства, изготовления лекарственных препаратов для придания им необходимых физико-химических свойств;



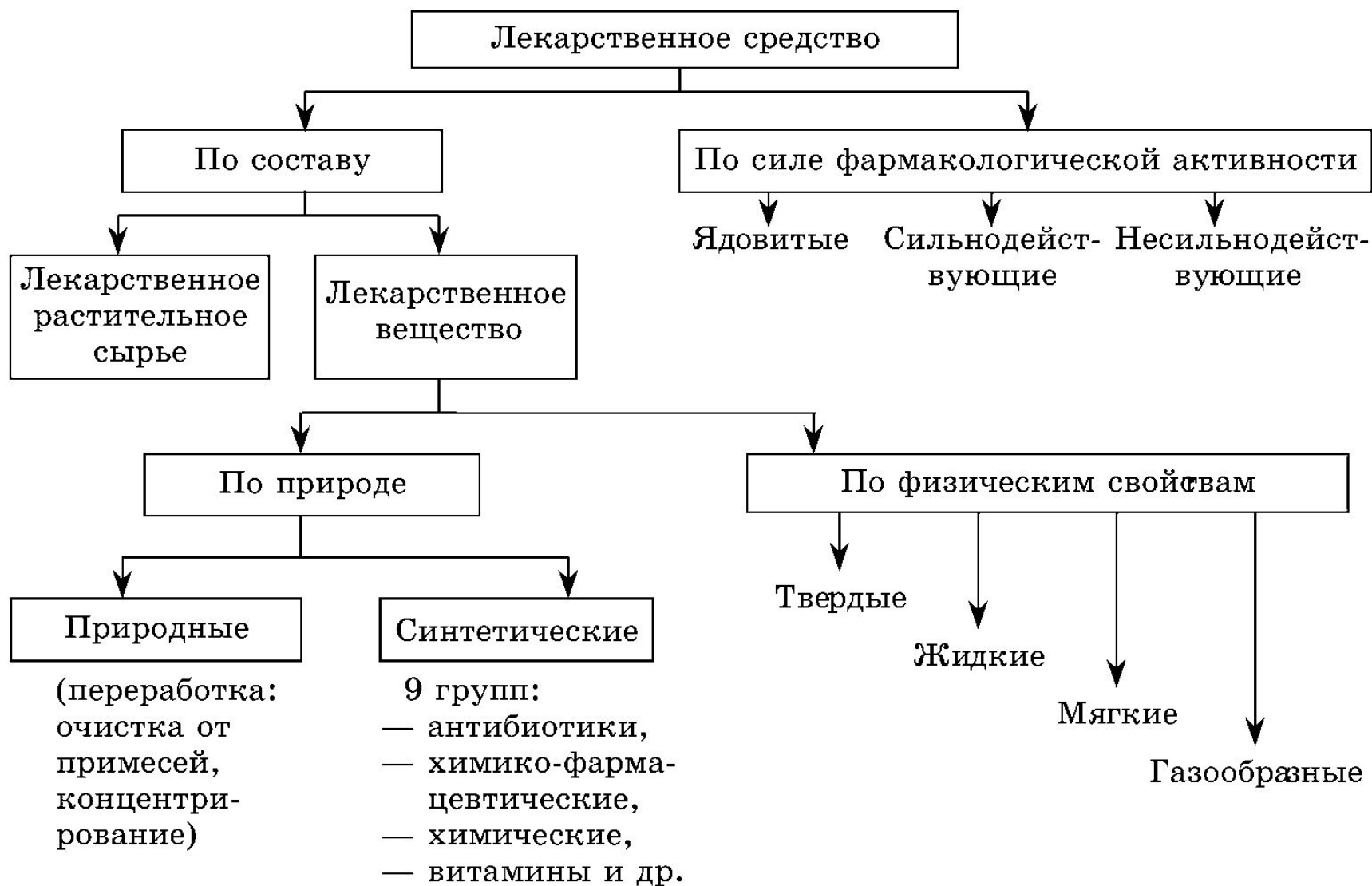
# ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА

## СИСТЕМА КЛАССИФИКАЦИИ





# ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА



## **КЛАССИФИКАЦИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ ПО ПРОИСХОЖДЕНИЮ**

- ▣ **1. Природные сырьевые материалы минерального, растительного, и животного происхождения, прошедшие первичную обработку (очистка от примесей, сушка, сортировка). К ним относятся:**
  - лекарственное минеральное сырье* — питьевая сода, активированный уголь, иловая лечебная грязь и пр.;
  - лекарственное растительное сырье* представленное различными морфологическими группами — сборы, листья, травы, цветки, плоды, семена, корни, корневища, кора и т.д.;
  - лекарственное сырье животного происхождения* — железы внутренней секреции домашних животных.

## ***КЛАССИФИКАЦИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ ПО ПРОИСХОЖДЕНИЮ***

**2. Лекарственные вещества синтетического или полусинтетического происхождения, полученные в результате переработки природных сырьевых материалов или целенаправленного синтеза**

**Эта группа делится на следующие подгруппы:**

- Химические препараты,*
- Химико-фармацевтические препараты*
- Препараты антибиотиков,*
- Витаминные препараты,*
- Органопрепараты,*
- Вакцины и сыворотки,*
- Продукты первичной переработки лекарственного сырья,*
- Галеновые препараты*



# ХИМИЧЕСКИЕ ВЕЩЕСТВА

- Химические вещества представляют собой индивидуальные химические соединения, а по своему происхождению — продукты синтеза или очищенных природных веществ.
- Их производит химическая промышленность.
- В своей основной массе они предназначены для обеспечения потребностей различных отраслей народного хозяйства, но многие из них одновременно являются и широко применяемыми лекарственными веществами, например, **натрия хлорид, натрия сульфат, серебра нитрат, кислота хлористоводородная, натрия гидрокарбонат, калия перманганат и т. д.**



# ХИМИКО-ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ ПРЕПАРАТЫ

Химико-фармацевтические препараты по своей природе также являются индивидуальными химическими продуктами.

Они вырабатываются предприятиями химико-фармацевтической промышленности и являются одной из основных и важных групп среди лекарственных средств, в которой преобладают продукты органического синтеза, например, **сульфаниламидные препараты** (*стрептоцид, норсульфазол, фтивазид и др.*).

Химико-фармацевтические вещества — **биологически активные вещества**, выделенные в чистом виде из сырьевых материалов растительного и животного происхождения (например, *алкалоиды, гликозиды и др.*).

Вещества **радиоактивных изотопов** представляют весьма активную группу химико-фармацевтических веществ, вошедших в лекарственный каталог. Благодаря *изотопам радиоактивных элементов* можно использовать внутриядерную энергию в виде лучевой энергии для наружного и внутрисполостного облучения.



# ВИТАМИНЫ

Витамины могут быть в виде индивидуальных химических соединений (*аскорбиновая кислота — витамин С, никотиновая кислота — витамин РР, рибофлавин — витамин В<sub>2</sub>*), а также в виде *экстрактов и концентратов*. Вырабатываются в основном предприятиями специализированной промышленности.



# АНТИБИОТИКИ

Антибиотики являются продуктами жизнедеятельности разных микроорганизмов.

Получают их путем биологического синтеза при выращивании микроорганизмов в разных средах.

- Широко известны антибиотики *пенициллин, биомицин, стрептомицин, грамицидин и др.*
- В большинстве случаев представляют собой индивидуальные химические соединения. Некоторые из них получают синтетическим (*левомицетин*) или полусинтетическим (*метициллин, оксациллин и др.*) способами.



# ОРГАНОПРЕПАРАТЫ

- Органопрепараты представляют собой сложные комплексы биологически активных гормональных веществ (адреналин).



- Получают их из органов, тканей и соков животного организма. Ряд гормонов **получают синтетически** (*половые гормоны*). К этой группе относятся ферменты (*пепсин и др.*).

Выпускаются предприятиями мясомолочной промышленности.





## ПРОДУКТЫ

### ПЕРВИЧНОЙ ПЕРЕРАБОТКИ ЛЕКАРСТВЕННОГО СЫРЬЯ

В эту группу входят **эфирные и жирные масла, жиры**, получаемые из частей растений и животных. Сюда же относятся многочисленные продукты, представляющие собой измельченные части растений и животных (например, **порошок клубней салепы, листья наперстянки, корни алтея и т. д.**), а также **порошки камедей, смол и пр.**



# ГАЛЕНОВЫЕ ПРЕПАРАТЫ

Характеризуются сложностью химического состава. В них наряду с действующими веществами содержатся и сопутствующие.

- Готовят их чаще всего из лекарственного растительного сырья (настойки, экстракты, масла, сиропы, ароматные воды и т. п.). Особую подгруппу в галеновых препаратах составляют так называемые **новогаленовые препараты**, представляющие собой также извлечения, но более полно освобожденные от балластных веществ (**алкалоиды**). Имеются и другие разновидности галеновых препаратов.



# ИММУНОЛОГИЧЕСКИЕ ВЕЩЕСТВА

- **Иммунологические вещества это вакцины и сыворотки или забитые микроорганизмы, разные антигены и антитела.**
- **Вырабатываются институтами вакцин и сывороток, институтами эпидемиологии, микробиологии и гигиены, а также рядом областных санитарно-эпидемиологических станций.**



# Классификация лекарственных форм



# ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

**Лекарственная форма** — состояние лекарственного препарата, соответствующее способам его введения и применения и обеспечивающее достижение необходимого лечебного эффекта;





o  
v  
o  
●



Согласно этой классификации, все лекарственные формы подразделяют на четыре группы:

- твердые,
- жидкие,
- мягкие,
- газообразные.



## Твердые лекарственные средства

Сборы, порошки,  
таблетки, драже, пилюли  
гранулы, твердые капсулы  
микросферы (пеллеты)...



## Жидкие лекарственные средства

Растворы, экстракты,  
микстуры, капли,  
примочки, суспензии,  
эмульсии...





## Мягкие лекарственные средства

**мази, пасты,  
пластыри,  
суппозитории, мягкие  
желатиновые капсулы...**



## Газообразные лекарственные средства

**газы,  
пары(распыленные  
жидкости), аэрозоли, спреи ...**



# КЛАССИФИКАЦИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ ПО АГРЕГАТНОМУ СОСТОЯНИЮ

- ▣ **Сборы** — смеси резаного или крупноизмельченного растительного лекарственного сырья, к которым иногда добавляют соли, эфирные масла или другие вещества.
- ▣ **Порошки** — лекарственная форма, обладающая сыпучестью.
- ▣ **Таблетки** — твердая дозированная лекарственная форма, получаемая путем прессования или формования лекарственного средства, а также смеси лекарственных и вспомогательных веществ.
- ▣ **Драже** — твердая дозированная лекарственная форма, получаемая послойным нанесением лекарственных веществ на микрочастицы инертных носителей с использованием сахарных сиропов.
- ▣ **Гранулы** — однородные частицы лекарственных средств округлой, цилиндрической или неправильной формы, содержащие смесь лекарственных и вспомогательных веществ



# КЛАССИФИКАЦИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ ПО АГРЕГАТНОМУ СОСТОЯНИЮ

- ▣ **Пилюли** — дозированная лекарственная форма в виде шарика от 0,1 до 0,5 г, приготовленная из однородной пластической массы, содержащей лекарственные средства и вспомогательные вещества.
- ▣ **Капсулы** — дозированные порошкообразные, гранулированные лекарственные вещества, заключенные в твердую оболочку.
- ▣ **Микросферы (пеллеты)** — сферические частицы с покрытием или без него, с размерами, измеряемыми в микрометрах. Микросферы служат исходным материалом при таблетировании или используются для наполнения капсул (определение появилось в 2006 г.).
- ▣ **Мази** — лекарственная форма мягкой консистенции для наружного применения; при содержании в мази порошкообразного средства свыше 25 % мази называют *пастами*.



# **КЛАССИФИКАЦИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ ПО АГРЕГАТНОМУ СОСТОЯНИЮ**

- ▣ **Пластыри** — лекарственная форма для наружного применения в виде пластичной массы, обладающей способностью после размягчения при температуре тела прилипать к коже.
- ▣ **Суппозитории (свечи)** — дозированные лекарственные формы, твердые при комнатной температуре и расплавляющиеся при температуре тела, предназначенные для введения в полости тела.
- ▣ **Растворы** — лекарственные формы, полученные путем растворения одного или нескольких лекарственных средств.
- ▣ **Микстуры** — жидкие лекарственные формы для внутреннего применения, дозируемые ложками.
- ▣ **Капли** — жидкие лекарственные формы, предназначенные для приема в виде капель в полость рта, ушей, глаз.



## ***КЛАССИФИКАЦИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ ПО АГРЕГАТНОМУ СОСТОЯНИЮ***

- ▣ ***Суспензия*** — жидкая лекарственная форма, содержащая в качестве дисперсной фазы одно или несколько измельченных порошкообразных веществ, распределенных в жидкой дисперсионной среде.
- ▣ ***Эмульсия*** - однородная по внешнему виду лекарственная форма, состоящая из взаимно нерастворимых тонкодиспергированных жидкостей.
- ▣ ***Линименты*** — густые жидкости или студнеобразные массы.
- ▣ ***Аэрозоль*** — лекарственная форма в специальной упаковке, в которой твердые или жидкие лекарственные вещества находятся в газе.





B

M

B





В зависимости от путей введения все лекарственные формы делят на две большие группы:

- ▣ **энтеральные** (вводимые через желудочно-кишечный тракт),
- ▣ **парентеральные** (которые вводят, минуя пищеварительный тракт).



# Энтеральный путь введения препарата включает в себя два способа:

## Пероральный

**Пероральный** (от лат. *per* — **через**, *orī*, *oris* — **рот**) — наиболее распространенный, простой и удобный путь введения лекарственного препарата, но данный путь введения не может быть использован для оказания быстрой лечебной помощи, а для некоторых веществ неэффективен.

Модификацией перорального пути является **сублингвальное** введение (под язык) и **перлингвальное** (на спинку языка) с целью местного и общего действия

## Ректальный

**Ректальный** (от лат. *rectus* — прямой) путь введения — **через прямую кишку** (*per rectum*) используют как в целях местного, так и общего действия. Данный путь введения удобен в детской практике, в гериатрии; для больных, находящихся в бессознательном состоянии.

Всасывание ЛС через 7-10 мин, Более 75% лекарственного вещества поступает сразу в общий кровоток, минуя печень.

**Строго соблюдать дозы ядовитых и сильнодействующих веществ.**



# Факторы, влияющие на поступление лекарственного вещества во внутреннюю среду организма при пероральном введении

- **Физико-химические свойства лекарственного вещества и лекарственной формы:** растворимость в воде и липидах, молекулярная масса, вкус и запах;
- **Функциональное состояние желудочно-кишечного тракта (ЖКТ):** кислотность желудочного сока, активность ферментов в желудке, заболевание ЖКТ;
- **Метаболизм лекарственного вещества в стенке кишечника и под влиянием микрофлоры;**
- **Взаимодействие лекарственного вещества с содержимым желудка и кишечника;**



# Парентеральный путь введения

Способы введения:

- **На кожный покров.** Наносят препараты в различных лекарственных формах (присыпки, припарки, мази, пасты, пластыри и др.). Действие лекарственных веществ при том может быть как **местным (локальным)**, так и **общим (резорбтивным или рефлекторным)**, благодаря наличию в коже значительного количества нервных окончаний. Всасывающая способность кожи увеличивается при наличии механических повреждений, гиперемии и мацерации кожи.
- **На слизистые оболочки: глазные, для носа, ушные, вагинальные лекарственные формы.** Слизистые оболочки обладают хорошей всасывающей способностью благодаря наличию большого количества капилляров. Слизистые оболочки лишены жировой прослойки, поэтому хорошо всасывают водные растворы лекарственных веществ.
- **С помощью ингаляционных форм вводят лекарственные вещества через дыхательные пути: газы (кислород, оксид азота, аммиак), легколетучие жидкости (эфир, хлороформ). Мало летучие жидкости можно вводить при помощи ингаляторов.** Достигается быстрое действие лекарственных веществ, так как происходит их прямое проникновение в кровоток
- **При помощи шприца. Лекарственные вещества быстро проникают в кровь и оказывают действие через 1-2 мин.** Инъекционные формы необходимы для оказания срочной помощи и введения ЛВ, разрушающихся в ЖКТ.

Клас



Г



# Дисперсология

- ▣ **Дисперсология**— учение о дисперсных системах. Она позволяет рассматривать все лекарственные формы с учетом наличия или отсутствия связи между частицами дисперсной системы; агрегатного состояния дисперсионной среды; характера раздробленности (измельченности) дисперсной фазы.
- ▣ В зависимости от наличия или отсутствия связи между частицами дисперсной системы различают две основные группы: **свободнодисперсные и связанодисперсные системы.**



# Свободнодисперсные системы

- В свободнодисперсных системах отсутствует взаимодействие между частицами дисперсной фазы или оно слабо выражено, благодаря чему частицы могут свободно перемещаться друг относительно друга под влиянием теплового движения или силы тяжести.
- Свободнодисперсными системами являются **растворы водные, растворы в вязких и летучих растворителях, микстуры, капли для внутреннего и наружного применения, полоскания, примочки и т.п.**



В зависимости от наличия или отсутствия дисперсионной среды и ее агрегатного состояния **свободнодисперсные** системы подразделяют на несколько подгрупп:

- системы без дисперсионной среды,
- системы с жидкой дисперсионной средой ,
- системы с пластично- или уруговязкой дисперсионной средой,
- системы с газообразной дисперсионной средой,
- системы с твердой дисперсионной средой.



# Системах без дисперсионной среды

В этом случае частицы твердого вещества не распределены в массе носителя, так как среда отсутствует. По дисперсности эти системы подразделяются на **грубодисперсные (сборы)** и **мелкодисперсные (порошки, гомеопатические тритурации)**. Получают их путем механического измельчения и перемешивания.

Основными свойствами являются: **большая удельная поверхность; соответствующий запас свободной поверхностной энергии; повышенная адсорбционная способность; подчиненность действию силы тяжести.**



# Системы с жидкой дисперсионной средой

*Системы с жидкой дисперсионной средой* — это все жидкие лекарственные формы.

По дисперсности фазы и характеру связи с дисперсионной средой выделяют следующие виды дисперсных систем:

- **растворы в различных растворителях** (истинные растворы или коллоидные растворы) ;
- **суспензии (взвеси)** — микрогетерогенные системы с твердой дисперсной фазой и жидкой дисперсионной средой. Граница раздела между фазами видна невооруженным глазом.;
- **эмульсии** — дисперсные системы, состоящие из двух жидкостей, не растворимых или слабо растворимых друг в друге;
- **комбинированные системы**. Происходит растворение, эмульгирование дисперсной фазы в дисперсионных средах разной вязкости.





# Системы с вязкопластичной дисперсионной средой

Системы с пластично- или упруговязкой дисперсионной средой – это могут быть растворы, золи, суспензии, эмульсии, комбинированные системы, могут представлять собой бесформенные системы, имеющие вид сплошной общей массы (мази, пасты), не имеющие геометрической формы, или сформированные (свечи, шарики, палочки), которые получают путем разлива в специальные формы или ручной изготовлением.



# Дисперсные системы пениной структуры

**Спумоиды** — дисперсные системы пенной структуры (от лат. *sputa* — пена), в которой жидкая или вязкопластичная среда представлена непрерывной, тонкой пленкой. Типичными спумоидами являются высококонцентрированные суспензии и эмульсии, пилюли.



# Системы с твердой дисперсионной средой

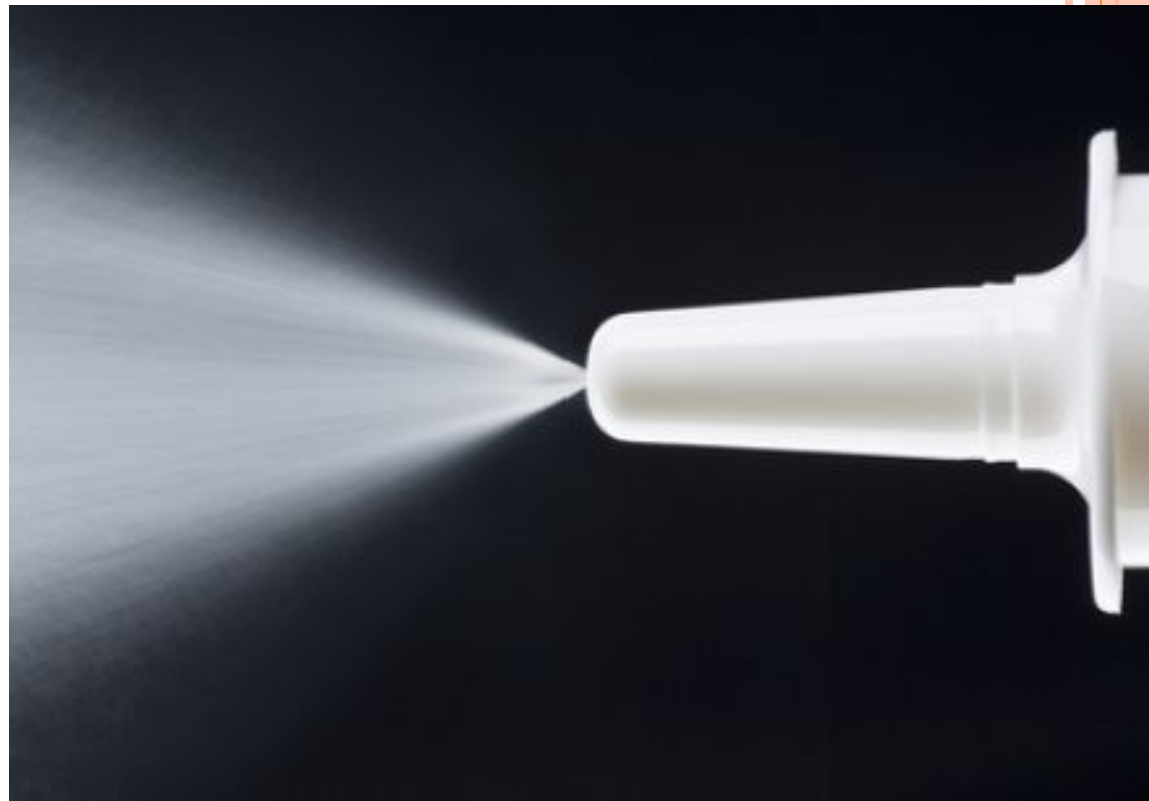
В системах с твердой дисперсионной средой дисперсная фаза может быть растворенной, в виде твердых частиц или эмульгированной. Наиболее часто применяются литые и прессованные шарики, медицинские карандаши, изготовленные на основе

жировых масс или твердых синтетических основ (например, полиэтиленоксидов).



# Системам с газообразной дисперсионной средой

К системам с газообразной дисперсионной средой относятся **газовые растворы, туманы, дымы: ингаляции, окуривания, курительные дымы, аэрозоли.**






# **Связнодисперсные системы**

Связнодисперсные системы состоят из мелких частиц твердых тел, которые соприкасаются друг с другом и **связаны молекулярными силами**, образуя при этом в дисперсионной среде пространственные сетки и каркасы.

Как правило, это твердые пористые тела, которые получают путем сжатия или склеивания порошков (**гранулы, прессованные таблетки, микродраже**), слая твердых кристаллитов (масло какао, твердый парафин, глицериновые свечи и т.д.).





**Классификация ЛФ  
по  
характеру  
воздействия на  
организм**



В соответствии с этой классификацией различают:

- **дозированные** (порошки, пилюли, таблетки, драже, растворы для инъекций в ампулах, пленки глазные);
- **недозированные** (микстуры, порошки, мази, некоторые гомеопатические лекарственные формы и др.).



## КЛАССИФИКАЦИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ ПО КАТЕГОРИЯМ

- ▣ Все лекарственные препараты можно разделить на две основные категории — **оригинальные** (они же брендовые) и **воспроизведенные** (или дженерики).
- ▣ Именно оригинальные лекарственные препараты отличает уникальное «клеймо» — запатентованное название и товарный знак. **Бренды** — впервые синтезированные лекарственные препараты, прошедшие полный цикл исследований, защищенные патентом на определенный срок. Полученный патент, срок действия которого определен в 20-25 лет, охраняет бренд на этот период от тиражирования и позволяет наиболее оптимально формировать ценовую политику
- ▣ **Дженерики** — воспроизведенные лекарственные препараты, взаимозаменяемые с их патентованными аналогами (оригинальными препаратами) и выведенные на рынок по окончании срока патентной защиты оригинального препарата





# ТРЕБОВАНИЯ К ЛЕКАРСТВЕННЫМ ФОРМАМ

- соответствие лечебному назначению, биодоступность лекарственного вещества в данной лекарственной форме и соответствующая фармакокинетика;
- равномерность распределения лекарственных веществ в массе вспомогательных ингредиентов и отсюда точность дозирования;
- стабильность в процессе хранения;
- соответствие нормам микробной контаминации, при необходимости консервирование;
- удобство приема, возможность исправления неприятного вкуса;
- КОМПАКТНОСТЬ



# *НАЗНАЧЕНИЕ ВСПОМОГАТЕЛЬНЫХ ВЕЩЕСТВ*



- Почти все известные в настоящее время лекарственные формы изготавливают с использованием вспомогательных дополнительных веществ.
- Однако выяснилось, что эти вещества могут в значительной степени влиять на фармакологическую активность лекарственных веществ: усиливать действие лекарственных средств или снижать их активность, изменять характер действия под влиянием разных причин, а именно — комплексообразования, молекулярных реакций и др.
- Правильным подбором вспомогательных веществ можно локализовать действие лекарственных средств.
- **В медицине и фармации применяют только те вещества, которые разрешены Фармакологическим и Фармакопейным комитетами Минздравсоцразвития России.**



- Вспомогательные вещества оказывают влияние на резорбцию (высвобождение) лекарственных веществ из лекарственного препарата, усиливая ее или замедляя, т.е. при использовании вспомогательных веществ можно регулировать *фармакодинамику* лекарственного вещества (совокупность эффектов, вызываемых лекарственным веществом) и его *фармакокинетику* (изменение во времени концентрации лекарственных веществ в органах и тканях).
- Так, например, мази, содержащие антибиотики и изготовленные на вазелине, в силу плохой резорбции малоэффективны. В данном случае лучше использовать основу, включающую 6 частей вазелина и 4 части ланолина. Правильным подбором вспомогательных веществ можно локализовать действие лекарственных средств. Например, для действия мази на эпидермис кожи используют вазелин, так как он не обладает способностью проникать в более глубокие слои кожи. Вспомогательные вещества могут ускорять или замедлять всасывание лекарственных веществ из лекарственных форм, влиять на фармакокинетику. Например, диметилсульфоксид, добавленный в глазные капли, ускоряет проникновение антибиотиков в ткани глаза. Использование же метилцеллюлозы позволяет удерживать лекарственные вещества в тканях длительное время, что обеспечивает пролонгированное действие, которое необходимо при многих хронических заболеваниях.



Механизм влияния вспомогательных веществ на лекарственный препарат может быть обусловлен следующими факторами:

- влиянием как дисперсной системы (стабилизация суспензий, эмульсий) на физико-химические свойства лекарственных веществ (средств) или лекарственной формы;
- взаимодействием вспомогательных веществ с лекарственными (химическое взаимодействие, комплексообразование, адсорбция).





Вспомогательные вещества влияют не только на терапевтическую эффективность лекарственного вещества, но и на физико-химические характеристики лекарственных форм в процессе их изготовления и хранения.

Добавление различных стабилизирующих веществ обеспечивает высокую эффективность лекарственных препаратов в течение длительного времени, что имеет не только большое медицинское, но и экономическое значение, так как позволяет увеличить срок годности лекарственных препаратов.



## ТРЕБОВАНИЯ К ВСПОМОГАТЕЛЬНЫМ ВЕЩЕСТВАМ:

- Должны быть **биологически безвредными и биосовместимы с тканями организма**, а также не оказывать аллергического и токсического действия;
- **Отсутствие химического и физико-химического воздействия с лекарственными веществами, упаковочными средствами**, а также материалами технологического оборудования в процессе изготовления ЛП и при их хранении;
- Должны придавать ЛФ **требуемые свойства** (структурно механические, физико-химические), не оказывать отрицательного влияния на вкус, запах, цвет ЛП;
- Проявлять **необходимые функциональные свойства при минимальном содержании в препарате**;
- Обеспечение проявления **надлежащего фармакологического действия ЛС с учетом его фармакокинетики**, обеспечивать биологическую доступность ЛС;
- **Быть экономически выгодными** ;
- Не должны ухудшать **физико-химические и структурно-механические свойства лекарственного препарата при хранении**;
- Соответствие изготавливаемого препарата требованиям предельно допустимой микробной контаминации (загрязнение микробами); выдерживать в случае необходимости стерилизацию;



# Влияние вспомогательных веществ на лекарственные препараты

## Влияние на фармакологическую активность

- Усиление или ослабление лекарственного средства.
- Обеспечение местного действия или общего воздействия на организм.
- Изменение скорости наступления эффекта.
- Обеспечение направленного транспорта или регулируемого высвобождения лекарственных веществ.

## Влияние на качество и стабильность

- Обеспечение стабильности: антимикробной; химической; физико-химической .
- Оптимизация технологических показателей (вязкости, растворимости, сыпучести, однородности).
- Корректирование органолептических свойств лекарственной препаратом (улучшение вкуса, запаха, цвета).







***КЛАССИФИКАЦИЯ  
ВСПОМОГАТЕЛЬНЫХ  
ВЕЩЕСТВ ПО  
ПРОИСХОЖДЕНИЮ***



# КЛАССИФИКАЦИЯ ВСПОМОГАТЕЛЬНЫХ ВЕЩЕСТВ

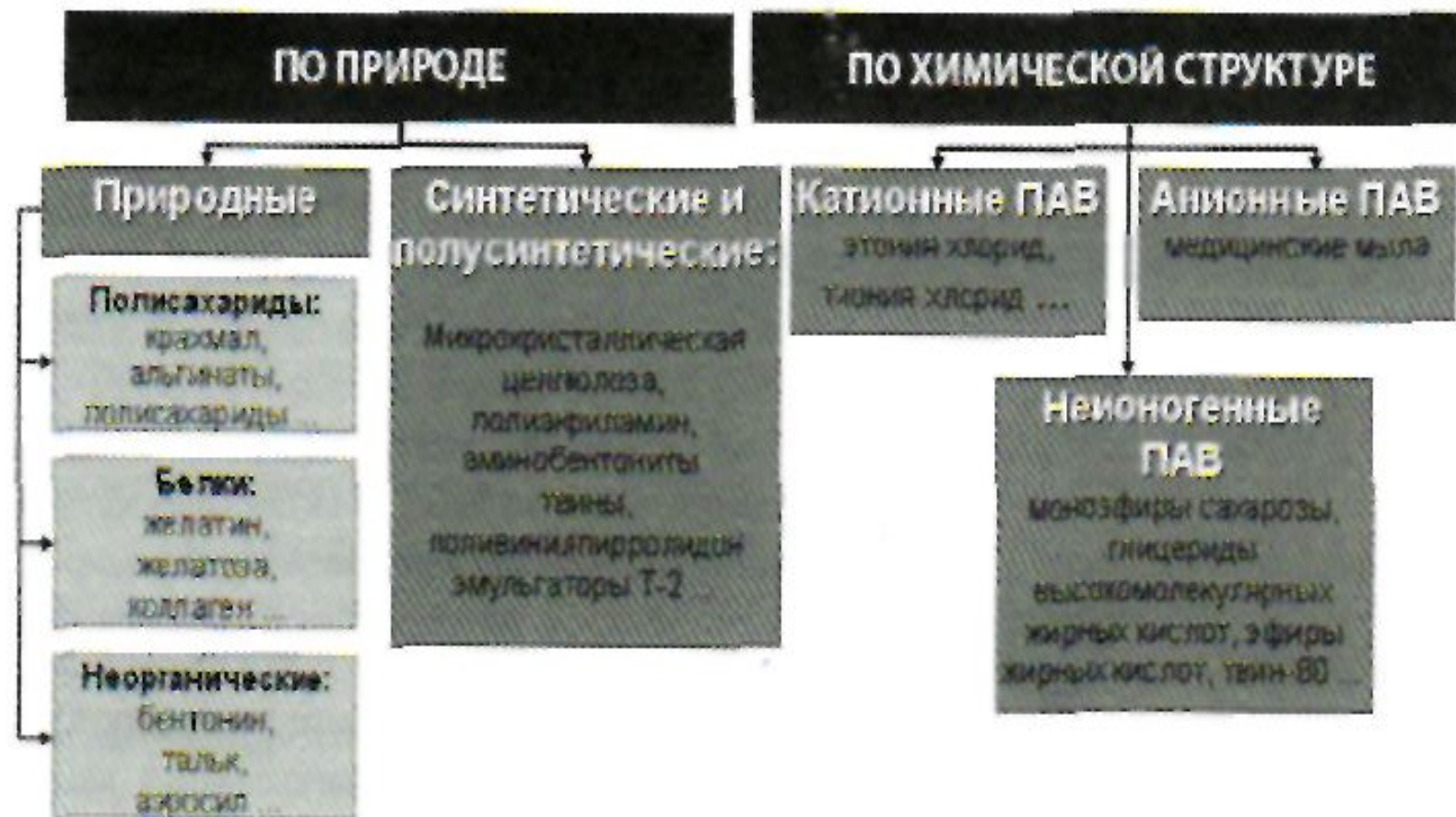


Рис. 1.3. Классификация вспомогательных веществ по природе и химической структуре

## Различают природные, синтетические и полусинтетические вещества

<b>Природные вещества</b>	<b>Примеры</b>	<b>Синтетические и полусинтетические вещества</b>	<b>Примеры</b>
Органические	Белки, жиры, полисахариды. спирты, эфиры, углеводороды и др.	Органические	ПЭГ, поливинол, поливинил-пирролидон, твины, эмульгатор Т-2 и др.
Неорганические	Тальк, глина белая, бентонит, природный модифицированный оксид кремния (оксил) и др.	Элементоорганические	Полноргано-силоксановые жидкости (эсилон-4, ЭСИЛОН-5), мыла и др.



# ПРИРОДНЫЕ ВСПОМОГАТЕЛЬНЫЕ ВЕЩЕСТВА


- **Природные** вспомогательные вещества получают путем переработки растительного, животного и микробиологического сырья и минералов.
- Их **преимуществом**, по сравнению с синтетическими, является высокая **биологическая безвредность**.
- Растительные биополимеры используют в качестве эмульгаторов, стабилизаторов, пролонгаторов и в других целях при производстве лекарственных форм.
- Природные вспомогательные вещества имеют существенный недостаток - они подвержены микробной контаминации, поэтому растворы полисахаридов и белков быстро портятся.
- Кроме того, в составе микрофлоры неорганических соединений могут обнаруживаться и патогенные микроорганизмы. В данном случае использование приемлемых методов стерилизации и добавление консервантов может исправить этот недостаток.



## СИНТЕТИЧЕСКИЕ И ПОЛУСИНТЕТИЧЕСКИЕ ВСПОМОГАТЕЛЬНЫЕ ВЕЩЕСТВА

- Синтетические и полусинтетические вспомогательные вещества широко применяются в технологии лекарственных форм.
- Это обусловлено их доступностью, т.е. возможностью синтеза веществ с заданными свойствами, более эффективных и менее токсичных. При получении полусинтетических вспомогательных веществ можно усовершенствовать свойства природных веществ.



A close-up photograph of a pile of small, white, spherical granules, likely fertilizer or a chemical additive, resting on a vibrant green leaf. The granules are densely packed in the center and spread out towards the edges of the leaf. The leaf's veins are clearly visible, and the background is a soft, out-of-focus green.

***КЛАССИФИКАЦИЯ  
ВСПОМОГАТЕЛЬНЫХ  
ВЕЩЕСТВ ПО ВЕЛИЧИНЕ  
МОЛЕКУЛЫ***

## ВСПОМОГАТЕЛЬНЫЕ ВЕЩЕСТВА ПОДРАЗДЕЛЯЮТ НА:

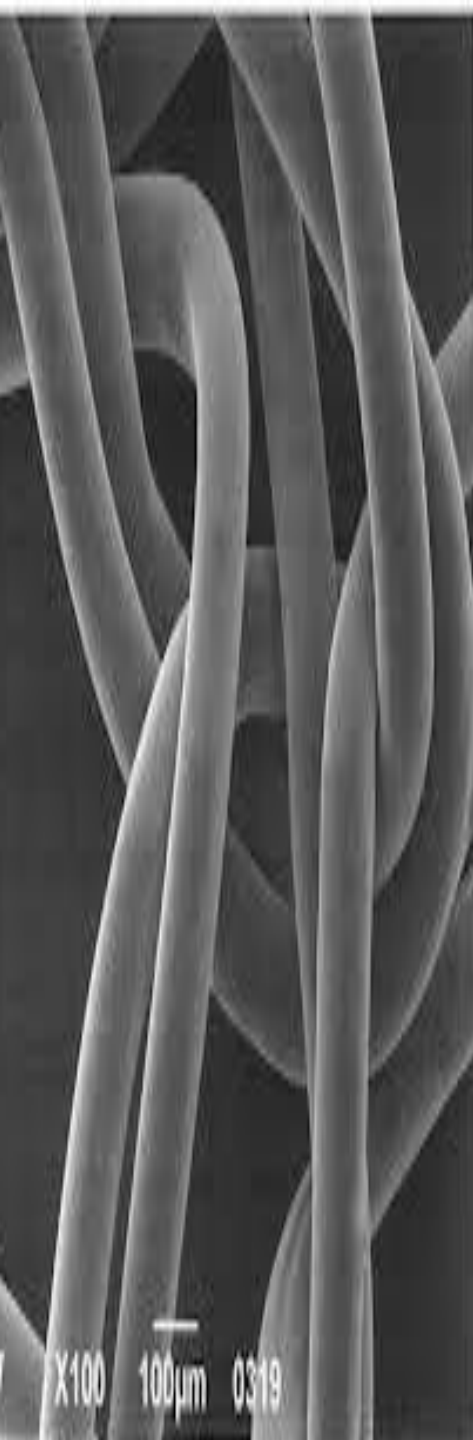
- низкомолекулярные;
- олигомеры  
(масса молекулы менее 10000);
- высокомолекулярные, или полимеры  
(масса молекулы более 10000).



# ВЫСОКОМОЛЕКУЛЯРНЫЕ ВЕЩЕСТВА (ВМВ)

Наиболее часто применяют в качестве вспомогательных веществ, т. к. образуют растворы различной вязкости в зависимости от концентрации. Их молекулы представляют собой длинные нити, переплетающиеся между собой или свернутые в клубки.

Применяют ВМВ в технологии практически всех лекарственных форм: как основы для мазей, суппозиториев, пилюль и др.; стабилизаторы; пролонгирующие компоненты; как упаковочные и укупорочные материалы. Введение в технологию новых ВМВ позволило создать новые лекарственные формы: многослойные таблетки длительного действия; спансулы; микрокапсулы; имплантируемые лекарственные формы и т. д...





## ПРОБЛЕМЫ, КОТОРЫЕ РЕШАЕТ ПРИМЕНЕНИЕ ПОЛИМЕРОВ:

- обеспечение биологической доступности, необходимой скорости наступления фармакологического эффекта или доставки к органу-мишени: контролируемое высвобождение, поддержание терапевтической концентрации в течение требуемого периода;
- повышение точность дозирования;
- снижение токсичности и побочности действия;
- маскирование неприятного вкуса и запаха;
- сохранение стабильности при хранении, предохранение лекарственных веществ от воздействия внешних факторов;
- обеспечение оптимальной упаковки и укупорку;
- повышение экономичности и эффективности производства.



# ТРЕБОВАНИЯ К ПОЛИМЕРАМ:

- Не должны содержать токсических мономеров,
- Должны выдерживать стерилизацию,
- Обладать оптимальным комплексом технологических (физико-химических и структурно-механических) свойств.
- К некоторым полимерам предъявляют требование растворимости в биологических средах.



***КЛАССИФИКАЦИЯ  
ВСПОМОГАТЕЛЬНЫХ  
ВЕЩЕСТВ ПО  
ФУНКЦИОНАЛЬНОЙ РОЛИ***



Вспомогательные вещества в зависимости от влияния на физико-химические характеристики и фармакинетику подразделяют на:

- формообразователи,
- стабилизаторы,
- солюбилизаторы,
- регуляторы

Высвобождения

и всасывания,

- корригенты



Вспомогательные вещества	Функции в лекарственной форме	Примеры
Твердые	Формообразование	Наполнители твердых ЛФ, (сахар, крахмал, тальк), пилюли (растительные порошки, экстракты) и др.
Жидкие		Дисперсионные среды (вода и неводные среды-этанол, растворители, экстрагенты. В технологии жидких лек. форм
Упруго-вязко-пластичные		Основы для мазей (вазелин, жир), пластификаторы, регуляторы температуры плавления.

Вспомогательные вещества	Функции в лекарственной форме	Примеры
Стабилизаторы физико-химических (дисперсных систем)	Стабилизация	Вещества, предотвращающие седиментацию, коагуляцию, коалесценцию, агрегацию, конденсацию.
Стабилизаторы (ингибиторы) химических процессов		Вещества, предотвращающие гидролиз, окисление, разложение и другие химические процессы.
Противомикробные стабилизаторы (консерванты)		Вещества, предотвращающие микробную контаминацию.

Вспомогательные вещества	Функции в лекарственной форме	Примеры
<p>В основном поверхностно-активные вещества (ПАВ)</p>	<p>Солюбилизация - процесс самопроизвольного перехода нерастворимого в воде вещества в разведенный раствор ПАВ с образованием термодинамически устойчивой системы</p>	<p>Вещества, способствующие мицеллярному растворению лекарственных веществ.</p>
<p>Активаторы всасывания; пролонгаторы</p>	<p>Пролонгирующие вещества (пролонгаторы)</p>	<p>Диметилсульфоксид, диметилформамид, ПАВ в низких концентрациях, МЦ, КМЦ, ПВП</p>

<b>Вспомогательные вещества</b>	<b>Функции в лекарственной форме</b>	<b>Примеры</b>
Вещества, улучшающие вкус, цвет, запах	Корригирование	Сиропы, эфирные масла, красители и др.
Регуляторы осмотических свойств растворов		Электролиты (натрия хлорид, натрия сульфат, натрия нитрат); глюкоза.
Регуляторы pH		Буферные растворы, кислоты, щелочи.