

А.К. Бошкаева, А.Е. Хамитова, Ғ.С. Ибадуллаева
Казахский Национальный медицинский университет имени С.Д. Асфендиярова
Школа фармации
Кафедра химико-фармацевтических дисциплин
Кафедра технологии лекарств и инженерных дисциплин

РАЗРАБОТКА СОСТАВА СУППОЗИТОРИЕВ НА ОСНОВЕ РАСТИТЕЛЬНЫХ ЭКСТРАКТОВ

В данной статье описано получение лекарственной формы-суппозитория на основе растительных экстрактов ромашки, пастушьей сумки, крапивы и красной щетки применяемая при геморрое. Были проведены контроль качества используемых экстрактов.

Ключевые слова: суппозиторий, геморрой, экстракт

Актуальность работы. Суппозитории являются широко распространенной дозированной лекарственной формой для ректального применения. Препараты в форме суппозитория в ведущих европейских странах включает около 1000 наименований. К преимуществам суппозитория перед другими ректальными формами относят простоту и удобство применения, относительную простоту технологии получения. В последнее время все большее внимание уделяется разработке готовых к применению растительных компонентов, определяющих состав ректальных суппозитория. Создание таких композиций позволяет увеличить выход биологически активных веществ (БАВ) из сырья и соответственно увеличить их процентную концентрацию в ректальной форме, а также повысить терапевтический эффект за счет точности дозирования.

Цели и задачи исследования. Целью работы является разработка новой лекарственной композиции и способа получения суппозитория, обладающего противовоспалительным действием со спектром применения в проктологии и гинекологии, не вызывающего побочных воздействий на организм человека и обладающего высоким терапевтическим эффектом.

Указанная цель обеспечивается новым технологическим режимом изготовления суппозитория, гарантирующим его высокое качество.

Известен ряд технологических режимов получения суппозитория на основе растительных экстрактов путем смешения компонентов. Однако параметры применяемого способа обусловлены свойствами каждого составляющего активного ингредиента.

Материалы и методы исследования. В данном случае подобран и опробован новый режим получения суппозитория на основе растительных экстрактов ромашки, крапивы, пастушьей сумки и красной щетки.

Результаты и обсуждение. Способ получения суппозитория на основе такой композиции заключается в том, что в нем используют сухие экстракты в виде порошков дисперсностью 0,5-1 мкм, которые первоначально смешивают с облепиховым маслом в пропорции 1:1,5, при температуре 36-38 °С в течение 10-15 мин, затем полученную смесь вводят в основу при температуре 36-38 °С, осуществляют интенсивное перемешивание в течение 5 мин, после чего готовую массу разливают в формы.

Отличительным признаком предложенной композиции суппозитория является то, что в качестве основы используются жир гидрогенизированный и масло какао, а в качестве целевой добавки облепиховое масло при следующем соотношении компонентов, в г на одну свечу:

Экстракт ромашки 0,050

Экстракт крапивы 0,050

Экстракт пастушьей сумки 0,050

Экстракт красной щетки 0,070

Облепиховое масло 0,075

Жир гидрогенизированный 0,12

Масло какао до получения массы 1,34



Рисунок 1 - Мацерация ЛРС на 70% спирте



Рисунок 2 - Получение экстрактов из ЛРС



Рисунок 3 - Полученные суппозиторий

Существенным признаком, характеризующим данный состав, является выбор составляющих ингредиентов и их количественных значений, дающих возможность в таком составе и интервале их содержания получить новый результат - создание суппозитория, обладающего противовоспалительным действием.

Сухие экстракты получали в виде аморфных, слегка комкующихся порошков серовато-кремоватого цвета или с коричнево-зеленоватым оттенком со специфическим запахом путем экстракции цветков ромашки аптечной (*Matricáriachamomilla*), листьев крапивы жгучей (*Urticadioica*), травы пастушьей сумки (*Capsélla búrsa-pastóris*) и корней и корневищ красной щетки (*Rhodiolaquadrifida*).

Определение подлинности, измельченности и содержания примесей в лекарственном растительном сырье вышеперечисленных растений проводили по общим требованиям и частным статьям нормативной документации. При испытании цветков ромашки были определены следующие показатели: осыпь (составляет не более 25 %); потеря в массе при высушивании (не более 12 %); общая зола (не более 13 %); количественное определение (на содержание эфирных масел - не менее 3 мл/кг; содержание флавоноидов в пересчете на лютеолин-7-гликозид - не менее 1,0 %). Цельные и измельченные листья крапивы содержат не менее 0,3 % суммы кофеилмаловой и хлорогеновой кислот в пересчете на хлорогеновую кислоту и 0,8 % суммы полифенольных соединений в пересчете на пирогаллол. Определены показатели качества сырья (листья крапивы): влажность сырья не превышает 14 %; общая зола - не более 20 %; зола, нерастворимая в хлороводородной кислоте - не более 4 %. Для сырья (травы пастушьей сумки) определены: потеря в массе при высушивании, которая составляет не более 13 %; органические примеси - не более 2 %; минеральные примеси - не более 1 %; вещества, извлекаемые спиртом (70 %) - не менее 10 %; общая зола - не более 10 %; зола, нерастворимая в хлороводородной кислоте - не более 2 %.

Для изготовления полученных экстрактов использован метод настаивания на 70 % спирте. Вытяжки освобождали от балластных веществ путем кипячения. Спиртовые экстракты отгоняли с помощью метода перегонки с водяным паром. Для сухих экстрактов определяли содержание тяжелых металлов по ГФ РК. Проводили определение по следующей методике: 1 мл жидкого экстракта выпаривали досуха, прибавляли 1 мл концентрированной серной кислоты, осторожно сжигали и прокаливали. Полученный остаток обрабатывали при нагревании 5 мл насыщенного раствора аммония ацетата. Фильтрацию проводили через беззольный фильтр, промывали 5 мл воды и доводили объем полученного фильтрата до объема 200 мл. По требованиям ГФ РК 10 мл полученного раствора должны выдерживать испытание на тяжелые металлы (не более 0,01 % в экстракте). К 10 мл раствора испытуемого экстракта, доведенного до нейтральной реакции разведенной уксусной кислотой, прибавляли 1 мл разведенной уксусной кислоты, 1-2 капли раствора сульфида натрия, перемешивали и через 1 минуту сравнивали с эталоном, состоящим из 10 мл 0,00005 % раствора свинец-иона и такого же количества реактивов, какое добавлено к испытуемому раствору. Окраска, появившаяся в испытуемом растворе, не превышала окраску эталонного раствора Б на свинец-ион.

Для приготовления суппозитория выбрали метод ручного выкатывания, который состоит из следующих основных технологических операций: а) приготовление массы; б) выкатывание и разрезывание стержня;

в) выкатывание свечей или шариков. Основу предварительно мелко измельчали. Целевую добавку и входящие в состав суппозитория основные вещества смешивали в фарфоровой ступке по изложенным выше правилам. Смесь уминали пестиком до получения однородной пластичной массы, легко отстающей от стенок ступки. Затем добавляли вспомогательные вещества - жир гидрогенизированный и масло какао. Полученную массу с помощью кусочка пергаментной бумаги сжимали в комок и переносили из ступки на пластмассовую пластинку и с помощью узкой деревянной дощечки, завернутой в пергаментную бумагу, выкатывали из нее цилиндрический стержень. Затем, легко надавливая резакком пиллюльного прибора на стержень, наносили деления соответственно числу приготавливаемых единиц суппозитория, в нашем случае 10, разрезали на отдельные порции. Каждую порцию массы при приготовлении свечей и шариков выкатывали дощечкой в виде шарика, а затем шарик, в случае приготовления свечей, придавали коническую форму с помощью наклонно поставленной дощечки. Основные испытания, регламентируемые ГФ РК для суппозиторий, осуществляются по следующим показателям качества: описание; идентификация; средняя масса и однородность массы; распадаемость; однородность содержания; время полной деформации или температура плавления; растворение; родственные примеси; микробиологическая чистота; количественное определение. Найденное отклонение от средней массы, указанной в прописи «Состав», не превышает $\pm 5\%$. Определение времени полной деформаций суппозитория производили в стеклянном приборе, состоящем из открытой с обоих концов трубки с капиллярным переходом и стержня с цилиндрическим утолщением на конце. Перед началом опыта трубку с короткого конца закрывали пробкой и наполняли водой при 37 °С. В длинный конец опускали стержень (массой 30 г) утолщением вниз и весь прибор помещали в сосуд с циркулирующей при 37 °С водой. Через 3-5 мин под стержень помещали суппозиторий острым концом вниз и одновременно включали секундомер. Время в минутах, в течение которого стержень опускался до такого положения, когда риска, нанесенная на нем, совпадает с уровнем трубки, принимается за время деформации, которое должно находиться в пределах 3-15 мин. Перед проведением опыта суппозиторий в течение 15 мин выдерживали на льду. В нашем случае время полной деформации составило 5-6 мин. Дальнейшие исследования связаны с фармакопейным анализом растительных экстрактов, используемых в качестве составляющих компонентов и их стандартизацией по разработанному проекту временного аналитического нормативного документа.

Вывод. Таким образом, предложенная технология получения ректального суппозитория позволила подобрать оптимальные технологические режимы его изготовления, обеспечивающие высокое качество предложенного лекарственного средства, технологичность процесса его изготовления.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

- 1 Гончарова Т.А. Энциклопедия лекарственных растений. — М.: Дом МСП, 1997. – 203 с.
- 2 Барабанов Е.И. Ботаника: учебник для студ. высш. учеб.заведений. — М: Издат. центр «Академия», 2006. - 448 с.
- 3 Фармакопейная статья N 42-1351-90 от 31.12.95. Свечи с экстрактом красавки.
- 4 Описание изобретения к патенту N 2026672, кл. А 61 К 3100, 9/00, опубл. 20.01.95.
- 5 Государственная фармакопея Республики Казахстан: первое издание. – 1 том. – Астана: Изд. дом «Жибекжолы», 2008. – 592 с.
- 6 Государственная фармакопея Республики Казахстан: первое издание. - Т. 2. – Алматы: Изд. дом «Жибекжолы», 2009. – 804 с.

А.К. Бошкаева, А.Е. Хамитова, Ғ.С. Ибадуллаева

С.Ж. Асфендияров атындағы Қазақ Ұлттық медицина университеті

Фармация мектебі «Химико-фармацевтикалық пәндер кафедрасы

Дәрілер технологиясы және инженерлік пәндер кафедрасы

ӨСІМДІК ЭКСТРАКТЫ НЕГІЗІНДЕ СУППОЗИТОРИЙ КҰРАМЫН ЖАСАУ

Түйін: Бұл мақалада гемморойға арналған түймедақ, жұмыршақ, қалақай, төрт қилы радиола өсімдік экстракты негізінде жасалған дәрілік қалыптың-суппозиторий алынуы сипатталады. Қолданылған экстрактілердің сапасының қадағалануы жүргізілді.

Түйінді сөздер: суппозиторий, гемморой, экстракт

A.K. Boshkaeva A.E. Khamitova,G.S.Ibadullayeva

Asfendiyarov Kazakh National medical university

School of pharmacy Department of Chemical and Pharmaceutical Disciplines Almaty

Department of Drug Technology and Engineering Disciplines

DEVELOPMENT OF THE COMPOSITION OF SUPPOSITORIES BASED ON PLANT EXTRACTS

Resume: This article describes the preparation of a suppository dosage form, based on plant extracts of chamomile, shepherd's purse, stinging nettle and red brush applied at Hemorrhoids.

Keywords: suppository, hamorrhoid, extract