

ВИЗНАЧЕННЯ ФІЗИКО-ХІМІЧНИХ ТА ФАРМАКОТЕХНОЛОГІЧНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ СУХОГО ЕКСТРАКТУ ШИШОК ХМЕЛЮ ЗВИЧАЙНОГО

Ключові слова: сухий екстракт, фармакологічні властивості, тверда лікарська форма

Розроблення нових оригінальних препаратів на основі субстанцій рослинного походження є актуальною задачею вітчизняної фармацевтичної науки і практики. Це також підтверджує той факт, що в останній час вчені приділяють значну увагу субстанціям рослинного походження, оскільки препарати на їхній основі мають низку переваг перед синтетичними. Незаперечними перевагами таких ліків є їх безпечність, ефективність та відсутність протипоказань. Фітопрепарати мають більш м'яку дію, менш токсичні, ніж синтетичні [6].

Виробництво твердих лікарських засобів починається з вивчення властивостей вихідних лікарських речовин, що дає змогу передбачити раціональний спосіб отримання фармацевтичного засобу та провести вибір виду і кількості допоміжних речовин [5].

Матеріали та методи дослідження

Метою нашої роботи є вивчення вихідних технологічних параметрів сухого екстракту шишок хмелю звичайного для розроблення на його основі твердої лікарської форми.

На кафедрі фармакогнозії НФаУ, (м. Харків) проведено фітохімічні дослідження шишок хмелю звичайного і розроблено технологію отримання сухого екстракту з них [3, 7, 8]. Вивчення фармакологічної активності сухого екстракту суплідь хмелю проводили на кафедрі фізіології з основами анатомії НФаУ [2, 4]. Ці дослідження дозволяють розглядати цю сировину як перспективне джерело фенольних сполук для створення на його основі фармакологічно активних субстанцій з протизапальною і репаративною активностями.

Сухий екстракт шишок хмелю – це аморфний, гігроскопічний порошок жовто-коричневого кольору, із специфічним ароматним хмельовим запахом і гіркуватим смаком. Легко розчинний у воді, частково – в 50 % і 70 % етанолі, нерозчинний в 96 % етанолі і органічних розчинниках [3].

Для вивчення вихідних параметрів досліджуваної субстанції ми використовували різноманітні методи дослідження. Кристалографічні показники з'ясували за допомогою лабораторного мікроскопу, обладнаного фотокамерою («Копус»); вологопоглинаючу здатність визначали за динамікою зміни ваги наважки за витримання субстанції в умовах різної вологості повітря; вологовміст визначали на приладі МА 150 фірми «Sartorius»; щільність до та після усадки, плинність, пресуємість – згідно з методиками ДФУ [1].

Результати дослідження та обговорення

Вивчення кристалографічних показників дає змогу прогнозувати необхідність використання деяких груп допоміжних речовин для розроблення складу та технології твердої лікарської форми. Також форма та розмір частинок зумовлюють технологічні

характеристики субстанції, такі як плинність, пресуємість, щільність та ін. [6].

Частинки порошку сухого екстракту за формою – прямокутники та багатокутники, є невелика кількість уламків голчастої форми. Результати дослідження представлено на рис. 1.

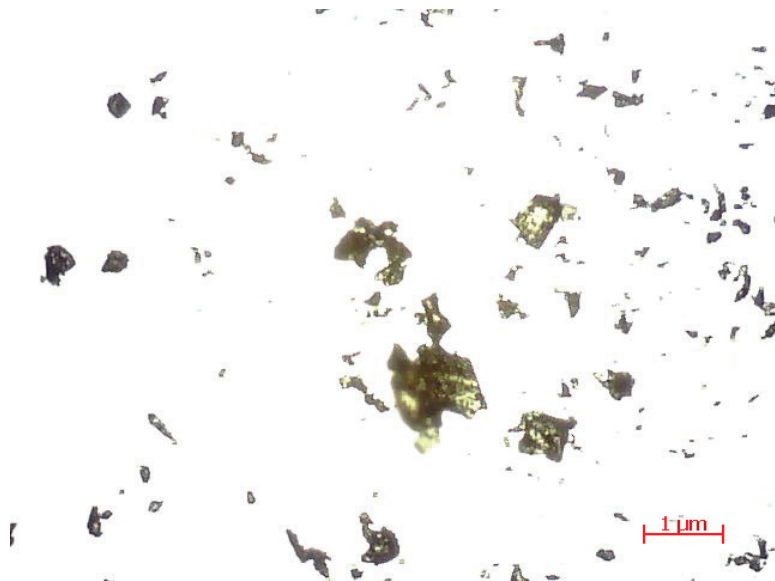


Рис. 1. Форма та розмір частинок порошку сухого екстракту шишок хмелю

Як відомо, сухі екстракти з лікарських рослин здатні добре поглинати вологу з повітря. Тому нами було проведено дослідження гігроскопічності сухого екстракту шишок хмелю.

В процесі витримки субстанції при 100 % вологості повітря, через 2 години після початку експерименту маса зразка, що досліджували, збільшилась вдвічі, а приблизно через 8 годин екстракт розчинився.

Результати експериментальних даних визначення вологопоглинання сухого екстракту шишок хмелю за відносної вологості повітря 45 % і 75 % наведено на рис. 2.

Як видно з рис. 2, за зниженої відносної вологості повітря вміст води в екстракті збільшується впродовж 5 год приблизно до 3,5 % і потім суттєво не змінюється. За відносної вологості повітря 75 % вологовміст субстанції збільшується практично до 9 %.

Проведені дослідження підтверджують дані літератури про гігроскопічність сухих екстрактів.

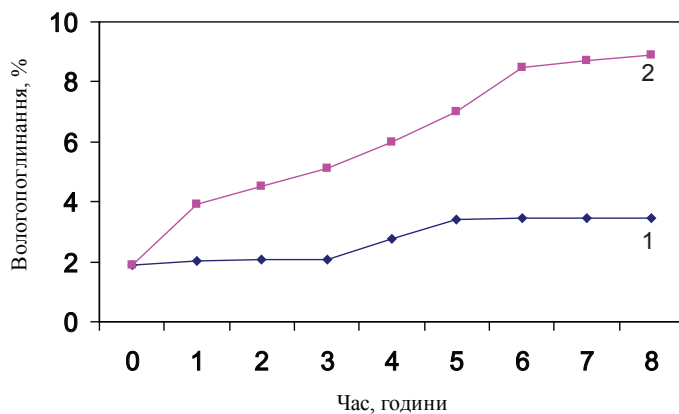


Рис. 2. Вплив відносної вологості повітря на вологопоглинання сухого екстракту шишок хмелю: 1 – 45 %; 2 – 75 %

Зі всіх фармакотехнологічних параметрів на процес отримання твердої лікарської форми більш за все впливає насипна маса, плинність, пресуємість і вологовміст субстанції. Тому нами було вивчено саме ці параметри. Результати досліджень представлено в таблиці.

Т а б л и ц я

Фармакотехнологічні властивості сухого екстракту шишок хмелю

Параметри	Одиниці вимірювання	Дані дослідження
Об'єм до усадки, V_0	мл	99,94±0,02
Об'єм після усадки, V_{10}	мл	84,95±0,06
Об'єм після усадки, V_{500}	мл	69,96±0,05
Об'єм після усадки, V_{1250}	мл	69,95±0,04
Здатність до усадки, $(V_{10} - V_{500})$	-	14,99±0,05
Щільність до усадки, (m/V_0)	г/мл	0,50±0,02
Щільність після усадки, (m/V_{1250})	г/мл	0,71±0,06
Плинність	с/100	47,75±0,04
Пресуємість	Н	95,0±1,2
Розпадання запресовки	хвилини	8,0±0,01
Вологовміст	%	1,89±0,04

Як видно з таблиці, субстанція, що досліджувалась, має оптимальний вологовміст та задовільні показники плинності. У процесі дослідження пресуємісті зразок прилипав до рук та до устаткування, що пояснюється гігроскопічністю досліджуваної субстанції. Показник пресуємісті набагато перевищував норму, але при цьому зразок розпався впродовж 8 хв, що підтверджує дані про добру розчинність сухого екстракту шишок хмелю і дає змогу зробити висновок про те, що немає необхідності використовувати розпушуючі речовини для своєчасного розпадання твердої лікарської форми.

Результати проведених досліджень дають змогу стверджувати необхідність використання допоміжних речовин з вологорегулюючими властивостями та доцільність проведення попередньої грануляції субстанції для оптимізації показників «вологопоглинання» та «плинність».

В и с н о в к и

1. Вивчені кристалографічні характеристики сухого екстракту шишок хмелю, значення яких свідчать про досить задовільну плинність субстанції.

2. Дослідження вологопоглинаючої здатності сухого екстракту свідчать про гігроскопічність досліджуваної субстанції.

3. Дослідження фізико-хімічних та фармакотехнологічних властивостей природної субстанції дає змогу прогнозувати склад і кількість допоміжних речовин та вибір технології отримання твердої лікарської форми.

Л І Т Е Р А Т У Р А

1. Державна фармакопея України / Держ. п-во «Науково-експертний фармакопейний центр». – 1-е вид. – Х.: РІРЕГ, 2001. – 556 с.

2. Уланова В. А., Гладченко О. М., Берестова С. І., Єфременко Е. А. Експериментальне вивчення протизапальних властивостей екстрактів з листя та шишок хмелю звичайного // Вісник фармації. – 2008. – №1 (53). – С. 72–75.

3. Мазурець С. І. Фармакогностичне дослідження хмелю звичайного (*Humulus lupulus L.*): Дисс. ... канд. фармац. наук : 15.00.02. – Харків, 2011. – 206 с.

4. Пат. 85925 Україна, МПК А61К 36/18, А61К 36/185, А61К 131/00. Спосіб одержання комплексу біологічно активних речовин з протизапальною та репаративною активністю / Ковальов С. В., Ковальов В. М., Берестова С. І., Малоштан Л. М., Гладченко О. М., Уланова В. А.; Національний фармацевтичний університет. – № а 2007 06251; Заявл. 06.06.2007; Опубл. 10.03.2009, Бюл. № 5.

5. *Перцев І.М., Дмитрієвський Д. І., Рибачук В. Д. та ін.* Допоміжні речовини в технології ліків: вплив на технологічні, споживчі, економічні характеристики і терапевтичну ефективність : навч. посіб. для студ. вищ. фар мац. навч. закл. – Харків: Золоті сторінки, 2010. – 600 с.

6. *Грошовий Т. А., Васенда М. М., Белей Н. М. та ін..* Сучасний стан створення, виробництва та дослідження таблетованих лікарських препаратів // Фармацевтичний часопис. – №. 4. – 2009. – С. 77–80. – Бібліогр.: С. 79–80.

7. *Alaniya M. D., Kavtaradze N. Sh.* Flavonol glycoside from *Humulus lupulus* // Chemistry of Natural Compounds. – 2010. – V. 46, № 4. – P. 641–645.

8. *Langezaal C. A.* A pharmacognostical study of *Humulus lupulus L.* // Pharmacy world and science. – 2007. – V. 15, № 4. – P. 178–179.

Надійшла до редакції 04.04.2012.

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

ОПРЕДЕЛЕНИЕ ФИЗИКО-ХИМИЧЕСКИХ И ФАРМАКОТЕХНОЛОГИЧЕСКИХ СВОЙСТВ СУХОГО ЭКСТРАКТА ШИШЕК ХМЕЛЯ ОБЫКНОВЕННОГО

Ключевые слова: сухой экстракт, фармакотехнологические свойства, твердая лекарственная форма

РЕЗЮМЕ

Для разработки твердой фармацевтической формы были изучены исходные технологические параметры сухого экстракта шишек хмеля. Результаты проведенных исследований позволяют утверждать необходимость использования вспомогательных веществ с влагорегулирующими свойствами и целесообразность проведения предварительной грануляции субстанции для оптимизации показателей «влагопоглощение» и «сыпучесть».

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

THE DETERMINATION OF PHYSICO-CHEMICAL AND PHARMACOTECHNOLOGICAL PROPERTIES OF DRY EXTRACT OF HOP CONES

Key words: dry extract, pharmacotechnological properties, solid dosage form

SUMMARY

Technological parameters of the original dry extract of hop cones were studied for the development of solid pharmaceutical forms. The results of these studies allow to confirm the need of the use of auxiliary substances with moisture-controlled properties and reasonability of pre-granulating of substance to optimize indices: “moisture absorption” and “flowability”