

УДК 615.454.2:616.65-002:001.891.53

К.В. Толочко, Т.Г. Ярних, В.М. Чушенко

Національний фармацевтичний університет

БІОФАРМАЦЕВТИЧНІ ДОСЛІДЖЕННЯ РЕКТАЛЬНИХ СУПОЗИТОРІЇВ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ПРОСТАТИТІВ

Проведені біофармацевтичні дослідження ректальних супозиторіїв для комплексного лікування простатитів. На підставі отриманих результатів обґрунтовано вибір супозиторної основи. Найбільш раціональною обрано супозиторна основа з твердого жиру типу А та лецитину, оскільки вона підходить для виготовлення супозиторіїв методом виливання як в аптечних, так і в промислових умовах. Результати досліджень використані при розробці технології супозиторіїв під умовною назвою «Трецивіт-прост».

Ключові слова: супозиторні основи; супозиторії; біофармація; простатит

ВСТУП

Існуючий асортимент простатопротекторів на українському фармацевтичному ринку наразі не задовольняє в повному обсязі потреби пацієнтів у препаратах комплексної дії. Також більшість препаратів має синтетичне походження та показана для лікування гострого простатиту та/або доброякісної гіперплазії передміхурової залози, тоді як найрозповсюдженішою формою простатиту є хронічний абактеріальний простатит (зустрічається у більш ніж 80% випадків захворювання на простатит) [2, 5, 7, 8, 9].

Нами була розроблена фармацевтична композиція з комплексною простатопротекторною активністю, діючими речовинами якої є екстракт кори осики сухий (ЕКОС), цинку сульфат та вітамін Е. Результати раніше проведених досліджень показали, що для лікування простатитів найбільш раціональною є лікарська форма супозиторіїв [4].

Для отримання належного терапевтичного ефекту супозиторіїв важливим є правильний вибір супозиторної основи, її реологічні та фізико-хімічні показники, вибір допоміжних речовин, технологічний процес тощо [1, 6].

Біофармація як особлива галузь у комплексі фармацевтичних наук дозволяє підібрати оптимальний склад носія супозиторіїв для гарантування їх стабільності та належного рівня фармакологічної активності.

Метою даної роботи було вивчення ступеня вивільнення ЕКОС з різних супозиторних основ та обґрунтування вибору оптимального носія супозиторіїв на основі отриманих результатів.

МАТЕРІАЛИ ТА МЕТОДИ

Об'єктами досліджень були супозиторії під умовною назвою «Трецивіт-прост», які відповідали вимогам ДФУ [1].

Співвідношення діючих речовин досліджуваних супозиторіїв на 1 супозиторій масою 3,0 г становить (мас. %):

Екстракт кори осики сухий	10,0–13,33
Цинку сульфату гептагідрат	3,33–5,00
Вітамін Е	3,33–5,00

Досліджувані зразки супозиторіїв готували на декількох супозиторних основах (табл.).

Для вивчення здатності супозиторної основи вивільняти ЕКОС були проведені дослідження *in vitro* методом дифузії в агаровий гель, заснований на утворенні забарвленої зони, яка з'являється в результаті взаємодії діючої речовини (фенольних сполук) з реактивом – 1% розчином заліза (III) хлориду.

Ступінь дифузії ЕКОС із досліджуваних зразків визначали по діаметру забарвленої зони, який вимірювали щогодини протягом 6 год та через 24 год. Статистичну обробку отриманих результатів проводили за методом Монцевічюте-Ерінгене [3].

РЕЗУЛЬТАТИ ТА ЇХ ОБГОВОРЕННЯ

Діаметри забарвлених зон зразків супозиторіїв як на гідрофобних, так і на гідрофільних основах поступово зростають, що свідчить про поступове та пролонговане вивільнення діючої речовини з супозиторних основ.

Вивільнення фенольних сполук з супозиторіїв на гідрофільній основі №1 значно перевищує вивільнення їх із супозиторіїв на гідрофобних основах. Але поліетиленоксидна основа виявляє

© К.В. Толочко, Т.Г. Ярних, В.М. Чушенко, 2012

високу осмотичну активність та дегідратуючі властивості, тому її використання для приготування ректальних супозиторіїв для лікування простатитів є нераціональним.

Таблиця

СКЛАДИ МОДЕЛЬНИХ СУПОЗИТОРНИХ ОСНОВ

№ п/п	Склад супозиторної основи	Кількість, мас. %
1	ПЕО 1500 ПЕО 400	90,0 10,0
2	Вітепсол Н32 Масло кокосове Емульгатор Т-2	88,7 10,0 1,3
3	Твердий жир типу А Лецитин	90,0 10,0
4	Масло какао*	100,0

Примітка: *супозиторії готували методом викачування.

Серед гідрофобних основ найменше вивільнення проходить з основи №2. Дослідження стійкості до руйнування показали, що супозиторії, приготовані на даній основі, не відповідають вимогам ДФУ (рівень стійкості до руйнування менше 1,6 кг), що свідчить про недоцільність використання даної основи у технології супозиторіїв «Трецивіт-прост».

На підставі отриманих результатів раціональними для приготування ректальних супозиторіїв були визначені основи №3 та №4.

Основа №4 має природне походження та добре переноситься пацієнтами при тривалому застосуванні. Але при приготуванні супозиторіїв даним методом існують складнощі при дозуванні супозиторної маси.

Обидва зразки супозиторіїв відповідають вимогам ДФУ та забезпечують належний рівень вивільнення фенольних сполук із супозиторіїв, але з технологічної точки зору основа №3 є більш раціональною, оскільки не потребує застосування додаткових технологічних прийомів та підходить для виготовлення супозиторіїв методом виливання, в тому числі у промислових умовах.

ВИСНОВКИ

1. На основі результатів біофармацевтичних досліджень доведено, що супозиторні основи № 3 та № 4 є найбільш раціональними для приготування ректальних супозиторіїв для лікування простатитів.

2. Оптимальним носієм розроблених супозиторіїв обрана супозиторна основа № 3, оскільки вона підходить для виготовлення супозиторіїв методом виливання як у аптечних умовах, так і в умовах промислового виробництва.

3. Отримані результати використані при розробці технології супозиторіїв під умовною назвою «Трецивіт-прост».

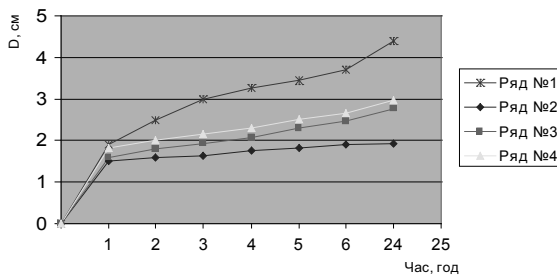


Рис. Залежність діаметра забарвленої зони від часу.

Ряд 1 – супозиторії «Трецивіт-прост» на основі №1.
Ряд 2 – супозиторії «Трецивіт-прост» на основі №2.
Ряд 3 – супозиторії «Трецивіт-прост» на основі №3.
Ряд 4 – супозиторії «Трецивіт-прост» на основі №4.

ПЕРЕЛІК ВИКОРИСТАНИХ ДЖЕРЕЛ ІНФОРМАЦІЇ

1. Державна фармакопея України / Державне підприємство «Науково-експертний фармакопейний центр». – 1-е вид. – Х.: РІРЕГ, 2001. – 556 с.
2. Лоран О.Б. Наше понимание проблемы хронического простатита / О.Б. Лоран, Д.Ю. Пушкар, А.С. Сегал, С.О. Юдовский // Фарматека. – 2002. - № 10. – С. 69-75.
3. Практикум по биофармации: [учеб. пособие для студентов вузов] / [А.И.Тихонов, Е.Е. Богущкая, Т.Г. Ярных и др.]; Под ред. А.И. Тихонова. – Х.: Изд-во НФаУ; Золотые страницы, 2003. – 96 с.
4. Толочко К.В. Анализ простатопротекторів за лікарськими формами, у яких вони надходять на фармацевтичний ринок / К.В. Толочко // Матер. Міжнар. наук.-практ. конф. [“Aktualne problemy nowoczesnych nauk. Т. 3. Ekonomiczne nauki.: Przemysł. Nauka I studia, 2008]. – S. 57-60.
5. Яковлева Л.В. Хронічний простатит / Л.В. Яковлева, Т.С. Сахарова, Н.Я. Музика // Рациональная фармакотерапия. – 2009. – №4 (13). – С. 55-57.
6. Ярных Т.Г. Изучение ассортимента супозиторных основ (обзор) / Т.Г. Ярных, Е.В. Толочко, В.Н. Чушенко // Химико-фармацевтический журнал. – 2010. - № 10 (44). – С. 21-26.
7. Donnell R.F. Chronic prostatitis cohort study / R.F. Donnell // Curr. Urol. Rep. – 2003. – Vol. 4, №1. – P. 12-15.
8. Moormann O. Chronic prostatitis/chronic pelvic pain syndrome / [O. Moormann, B. Planz, H.P. Caspers et al.] // Schmerz. – 2004. – Vol. 18, №2. – P. 125-129.
9. Nickel J.C. Management of men diagnosed with chronic prostatitis/chronic pelvic pain syndrome who have failed traditional management / [J.C. Nickel, A.P. Baranowski, M. Pontari et al.] // Rev. Urol. – 2007. – Vol. 9, № 2. – P. 63-72.

УДК 615.454.2:616.65-002:001.891.53

Е.В. Толочко, Т.Г. Ярних, В.Н. Чушенко

БИОФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ ИССЛЕДОВАНИЯ РЕКТАЛЬНЫХ СУППОЗИТОРИЕВ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ПРОСТАТИТОВ

Проведены биофармацевтические исследования ректальных суппозиториев для комплексного лечения простатитов. На основании полученных результатов обоснован выбор суппозиторной основы. Наиболее рациональной определена суппозиторная основа из твердого жира типа А и лецитина, поскольку она подходит для приготовления суппозиториев методом выливания как в аптечных, так и в промышленных условиях. Результаты исследований использованы при разработке технологии суппозиториев под условным названием «Трецивит-прост».

Ключевые слова: суппозиторные основы; суппозитории; биофармация; простатит

UDC 615.454.2:616.65-002:001.891.53

K.V. Tolochko, T.G. Yarnykh, V.M. Chushenko

BIOPHARMACEUTICAL RESEARCH OF RECTAL SUPPOSITORIES FOR TREATMENT OF PROSTATITIS

Biopharmaceutical research of rectal suppositories for treatment of prostatitis was conducted. Choice of the suppository base is grounded on the basis of the received results. Suppository base from hard fat of type A and lecithin is chosen as the most rational, as it suits for preparation of suppositories by the casting method both in the conditions of the chemist's shop and in the production conditions. The results of the research are used by development of the technology of suppositories under conditional name «Trezivit-prost».

Key words: suppository bases; suppositories; biopharmacy; prostatitis

Адреса для листування:
61158, м. Харків, вул. Блюхера, 4.
Кафедра аптечної технології ліків
ім. Д.П. Сала НФАУ.
Тел. роб. (0572)67-91-84.
E-mail:tolochko-ev@rambler.ru

Надійшла до редакції:
23.12.2011