

УДК 615.454.1:001.891.53

И. В. УЛИЗКО¹, В. В. ТРОХИМЧУК²¹Одесский национальный медицинский университет, г. Одесса, Украина²Национальная медицинская академия последипломного образования

им. П.Л. Шупика, г. Киев, Украина, e-mail: prom_farm@i.ua

ИЗУЧЕНИЕ ОСМОТИЧЕСКИХ СВОЙСТВ ГЕЛЯ НА ОСНОВЕ МЕЛОКСИКАМА И ГУСТОГО ЭКСТРАКТА СИРЕНИ

Поиск высокоэффективных лекарственных средств для лечения заболеваний опорно-двигательного аппарата приобретает большую актуальность, среди которых перспективными считаются нестероидные противовоспалительные средства (НПВС), так как именно они составляют основу лечения суставных синдромов и представляют собой обширную по химическому строению и фармакологическим эффектам группу лечебных средств. Наиболее известным из НПВС является мелоксикам (МК) [2, 5].

В последнее время на фармацевтическом рынке представлены лекарственные средства с мелоксикамом, как «Артрозин» и «Мовалис», таблетки по 7,5 и 15 мг. Однако, как показала практика, использование мелоксикама в пероральных средствах приводит к развитию типичной острой язвы желудка, что обусловлено ulcerогенностью. Этого недостатка лишены лекарственные формы для наружного применения, среди которых наиболее востребованы гели, к преимуществам которых следует отнести: близкие значения pH до нейтрального, быстро изготавливаются без использования высоких температур, не закупоривают поры кожи и равномерно распределяются на ее поверхности.

Для решения поставленных задач исследователи и практические работники все чаще обращают внимание на лекарственные препараты природного происхождения, содержащие большое количество биологически активных соединений, часть которых имеют противовоспалительную активность [1].

Современный подход к проблеме разработки состав мягких лекарственных форм и их технологии обязательно предполагает тщательное и всестороннее исследование всех биофармацевтических аспектов получения и назначения лекарственного средства. Для достижения желае-

мого терапевтического эффекта необходимо учитывать не только физико-химические свойства лекарственных веществ, характер заболевания, состояние кожи и слизистой оболочки, но и свойства вспомогательных веществ, в частности в технологии мазей – свойства основы. Правильно подобрав основу, можно обеспечить высокую фармакологическую активность препарата в данной форме или значительно уменьшить ее токсичность. Интенсивное выделение и резорбцию действующих веществ эффективно обеспечивают гелевые и эмульсионные мазевые основы [3,4].

Цель работы. Изучение осмотической активности нового противовоспалительного геля на основе мелоксикама и густого экстракта цветков сирени.

Материалы и методы исследования. Объектом изучения является гель на основе густого экстракта сирени и мелоксикама, обладающий противовоспалительным и мембраностабилизирующим действием. Концентрации действующих веществ были установлены экспериментальным путем и составляли 1% мелоксикама и 3% густого экстракта сирени.

Основу мази составляют смесь глккообразователей (карбопола и ксантана), неводных растворителей и ПЕГ-40 гидрогенизированного касторового масла. Гелевые основы характеризуются не высокими осмотическими свойствами. Необходимо отметить, что использование различных неводных растворителей позволяет создать системы с регулируемой осмотической активностью.

Осмотическую активность мазей оценивали по степени адсорбции жидкости через полупроницаемую мембрану в анализируемый образец через равные промежутки времени. В качестве полупроницаемой мембраны был использован инертный пористый целлюлозный материал Curophan Type 150 pm. В качестве препарата сравнения использовали 1% гель натрия диклофенака промышленного производства. Величину адсорбции определяли относительно начальной массы.

Результаты и их обсуждение. Полученные данные представлены на рисунке в виде кривых, которые отражают количество поглощенной жидкости (ΔP , мас.%) в течение времени.

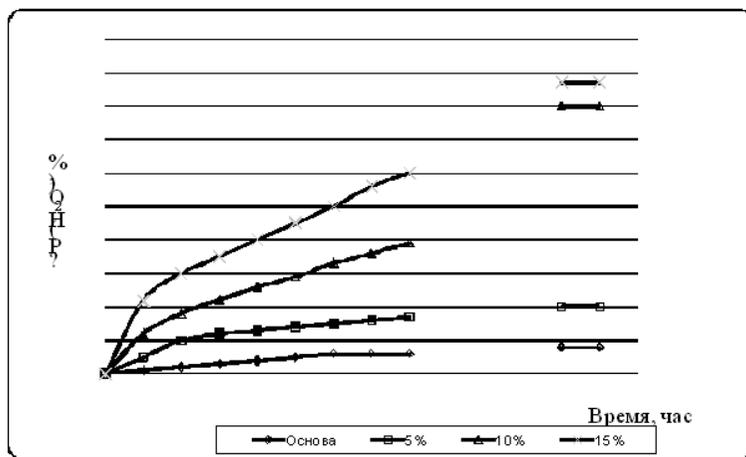


Рис. 1. Кинетика абсорбции воды гелем мелоксикама и густого экстракта сирени в зависимости от количества пропиленгликоля в составе

Как видно из рисунка, общая масса абсорбционной воды основной геля составила менее 10%, что доказывает практическое отсутствие осмотической активности.

Введение в гель пропиленгликоля значительно повысило дегидратирующую способность основы.

Так, составы с пропиленгликолем в концентрации больше 10% были осмотически активные 6-8 часов. Это можно объяснить тем, что в пропиленгликоле наиболее выражена склонность к межмолекулярному взаимодействию с водой. Используя эти качества, пропиленгликоль позволяет создавать основы мягких лекарственных средств с длительным и, в то же время, мягким осмотическим эффектом. Поэтому для дальнейшей разработки состава геля была выбрана 10 % концентрация пропиленгликоля, которая и обеспечивает необходимые осмотические свойства лекарственному средству.

Выводы. Полученная величина осмоса позволяет предотвратить раздражающее действие на кожные покровы и клетки эпителия в фазе воспаления. Это позволяет сделать вывод, что разработанный состав обеспечивает уровень осмотической активности, необходимый для гелей, используемых в терапии заболеваний опорно-двигательного аппарата.

Литература

1. Бутко Я. А. Фармакокоррекция раневого процесса // Провизор. 2007. № 15. С. 26-32.
2. Годзенко А. А. Перспективы применения мелоксикама в лечении суставных синдромов // Русский медицинский журнал. 2006. Т. 14. № 25. С. 1846-1848.
3. Фармацевтические и биологические аспекты мазей: монография / И.М. Перцев, А.М. Котенко, О.В. Чуешов, Е.Л. Халеева; под. ред. И. М. Перцева. Х.: Изд-во НФаУ: Золотые страницы, 2003. 288 с.
4. Перцев И. М. Значение осмотических свойств мазей при их использовании в медицинской практике / И.М. Перцев, Н.Н. Беркало, С.А. Гуторов, В.В. Постольник // Вестник фармации. 2002. № 2 (30). С. 7-10.
5. Clinical Pharmacokinetics of Meloxicam / D. Turck [et al.] // *Arzneim. Forsch.* 2007. Vol. 7, № 3. P. 253-258.