



FÉLSZILÁRD KÉSZÍTMÉNYEK SEGÉDANYAGAI

2020.02.19.

PTE GYTK Gyógyszertechnológiai és Biofarmáciai Intézet

Vörös-Horváth Barbara

KÚPOK

Ph.Hg. VII.

A végbélkúpok, hüvelykúpok- és hengerek a testüregekben alkalmazott, a test hőmérsékletén megolvadó vagy a testnedvekben feloldódó gyógyszerkészítmények. Ezek a hatóanyagot emulziós, szuszpenziós vagy oldott formában tartalmazzák.

Ph.Hg. VIII.

Nincs egységes definíció. A beviteli kapuk szerinti csoportosítások között találunk félszilárd gyógyszerkészítményeket:

- Végbélben alkalmazott/rektális gyógyszerkészítmények (Rectalis)
- Hüvelyben alkalmazott/vaginális gyógyszerkészítmények (Vaginalia)
- Gyógyszeres pálcikák (Styli)
- Orrüregben alkalmazott/nazális készítmények (Nasalia)

Fo.No.VII.

A végbélkúp (suppositorium) a végbélben, a hüvelykúp (ovulum), hüvelygolyó (globulus), hüvelyhenger (globulus longiformis) és a húgycsőpálca (bacillus urethralis) a vonatkozó testüregben testhőmérsékleten megolvadó vagy a testnedvekben feloldódó gyógyszerkészítmény. A gyógyszeres rúd (pertica) a bőrfelület kezelésére alkalmazott gyógyszerkészítmény.

E gyógyszerkészítmények hatóanyag(ok)ból és készítményalapból állnak.

KÚPOK SEGÉDANYAGAI

Készítményalapok

A Fo.No. VII.-ben hivatalos készítményalapok:

- Szilárd zsír
- Tenzideket tartalmazó szilárd zsír
- Makrogol elegy
- Kakaóvaj

Csoportosításuk oldékonyság szerint.

- Vízben nem oldódó, lipofil készítményalapok
 - Adeps solidus 50
 - Adeps solidus 3
 - Butyrum cacao
- Vízrel nedvesítő, lipohidofil készítményalap
 - Adeps solidus compositus
- Vízben oldódó, hidofil készítményalap
 - Massa macrogoli

TÖLTŐANYAGOK

Kis mennyiségű hatóanyag megfelelő, pontos adagolását teszik lehetővé. A megfelelő segédanyag megválasztásánál figyelembe kell venni az egyéni érzékenységeket (pl. diabétesz, laktóz intolerancia).

- Cukrok
 - Lactosum
 - Saccharosum
- Cukoralkoholok
 - Mannitum
 - Sorbitum

TÖLTŐANYAGOK

Lactosum (Ph.Hg. VII.): Laktóz

Leírás: Fehér, kristályos por. Szagtalan. íze gyengén édes.

Oldékonyság: Vízben bőségesen oldódik; 90%-os alkoholban alig oldódik.

Jól záró edényben tartjuk. Inkompatibilitás: Savanyú közeg, lúgos közeg.

Gyógyszertechológiai vonatkozás: Töltőanyagként használjuk (pilulák, kúpok stb.). B-D-galaktózból és α -D-glükózból álló diszacharid monohidrátja. Rideg kristályokból áll, amik préseléskor inkább törnek, mint plasztikusan deformálódnak, ezért általában kombinálják más töltőanyagokkal. Rosszul oldódó hatóanyagok oldhatóságát elősegíti.

TÖLTŐANYAGOK

Saccharosum (Ph.H g.V II.): Szacharóz

Leírás: Fehér, kristályos törésű darabok vagy színtelen, apró kristályok, illetőleg fehér, kristályos por. Szaga nincs. Íze édes. Hevítve megolvad, majd megbámul és égett cukor szagot áraszt. Erősebb hevítéskor elszenesedik, és izzítva elég.

Oldékonyság: Vízben nagyon bőségesen oldódik, 90 %-os alkoholban mérsékelten oldódik. Éterben és kloroformban gyakorlatilag nem oldódik.

Zárt edényben tartjuk. Inkompatibilitás: Lúgos közeg; savanyú közeg; oxidáló anyagok.

Gyógyszertechnológiai vonatkozás: Kellemes édes íze miatt ízjavítóként alkalmazzuk perorális készítményekben. B-D-fruktózból és α -D-glükózból álló diszacharid. A diszperziós közeg sűrűségének növelésére alkalmazzák. Alkalmazása cukorbetegéknél fokozott figyelmeztetés igényel!

TÖLTŐANYAGOK

Mannitum

Leírás: Fehér vagy csaknem fehér kristályos por, gördülékeny szemcsék. Szagtalan, édes ízű.

Oldékonyság: vízben bőségesen, alkoholban mérsékelten oldódik.

Felhasználás, gyógyszer technológiai vonatkozás: diureticum. Polimorfiára hajlamos cukoralkohol. Hőstabil, ezért hővel sterilezhető. A mannit a szervezetben nem metabolizálódik, a gyomor-bélcsatornából nem szívódik fel, ezért ozmotikus hashajtónak is alkalmazható. Lúgos közeggel inkompatibilis. (E 421)

TÖLTŐANYAGOK

Sorbitum (Ph.H g. VII.): Szorbit

Leírás: Fehér, kristályos por. Szagtalan. íze édes. Levegőn nedvességet szív.

Oldékonyság: Vízben nagyon bőségesen oldódik, 90 %-os alkoholban oldódik.

Jól záró edényben tartjuk. Inkompatibilitás: Lúgos közeg.

Gyógyszertechnológiai felhasználás: Hatértékű cukoralkohol. A gyógyszerkészítésben gyakran használt segédanyag. Használható ízjavítóként. Előnye, hogy cukorbeteg is fogyaszthatják, mert a sejtekbe való felvétele inzulinfüggetlen. Szorbit szirupot használhatunk pilulakészítéskor kötőanyagként. Levegőn nedvességet vesz fel. (E 420)

EGYÉB SEGÉDANYAGOK

Viszkozitásnövelő anyagok

Kúpok öntésénél a szuszpendált hatóanyag ülepedésének megakadályozására vagy lassítására alkalmazzák.

- Acidum silicicum colloidalis hydrophylum
 - 0,5-2%-os mennyiségben alkalmazzák.
- Glycerinum monostearicum
 - 2-5% koncentrációban

Konzisztencia lágyító anyagok

Nagy poranyag tartalmú, túl kemény kúpok konzisztenciájának lágyítására alkalmazott segédanyagok.

- Oleum neutrale (2-10%-os mennyiségben)

Folyadékmegekötő anyagok

- Acidum silicicum colloidalis hydrophylum

Alkalmazásuk nagyobb mennyiségű folyékony komponenst tartalmazó kúpok előállítása során történik → préseléses technológia megkönnyítésére.

KONZISZTENCIA LÁGYÍTÓ ANYAGOK

Oleum neutrale – Triglycerida saturata media

Telített, közepes lánchosszúságú trigliceridek keveréke

Leírás: színtelen vagy halványsárga, olajszerű folyadék. Szagtalan, íztelen.

Oldékonyság: alkohollal elegyedik.

Felhasználás: a Ph.Hg. VII.-ben hivatalos semleges olaj, közepes, átlagosan 8-12 szénatomszámú telített zsírsavak trigliceridjeinek keveréke. Elsősorban oldószerként alkalmazzák, illetve kenőcsök és kúpok konzisztencia lágyítására. A bőrön jól szétterül, nem zavarja a bőrlégzést, jó penetrációs tulajdonságú, a bőrön nem látható filmet képez. Inkompatibilitás műanyag csomagolóanyagokkal.

EGYÉB SEGÉDANYAGOK

Diszpergálószer

Száraz kivonatok jobb eloszlatására alkalmazzák.

- Aqua destillata

Olvadási, ill. dermedési hőmérsékletet növelő anyagok

Alkalmazásuk akkor szükséges, ha a komponensek hatására csökken a készítményalap olvadáspontja, illetve dermedéspontja, így a megfelelő gyógyszerforma kialakítása nehézkes vagy egyáltalán nem lenne lehetséges.

- Cera alba
- Cetacetum
- Alcoholum cetylstearylicum

OLVADÁSI, ILL. DERMEDÉSI HŐMÉRSÉKLETET NÖVELŐ ANYAGOK

Cera alba (Ph.Hg. VII.): Fehér viasz

Sárga méhviaszból fehérítéssel előállított viasz. A méhviasz mézre jellemző szagú, sárga vagy sárgásbarna színű viasz, amely a mézelő méh által készített lépfal forró vízzel történő megolvasztásával nyert, idegen anyagoktól megtisztított viasz.

Leírás: Fehér vagy kissé sárgás színű anyag. Csaknem szagtalan. Szobahőmérsékleten szilárd és nem tapad. A kéz melegén meglágyul, és gyúrhatóvá válik.

Oldékonyság: Vízben nem oldódik. Forró 90 %-os alkoholban részben oldódik. A megolvasztott fehér viasz a megolvasztott vazelinnal, paraffinnal stb. minden arányban elegyedik.

Fedett edényben tartjuk.

Gyógyszertechnológiai tulajdonság: Cseppenéspontja 61-66°C. Kenőcsalapanyag, az ún. összetett lipogélek komponense a gyapjúviasz, zsíralkoholok, és növényi olajok mellett. A kozmetikai ipar is használja. (E 901)

OLVADÁSI, ILL. DERMEDÉSI HŐMÉRSÉKLETET NÖVELŐ ANYAGOK

Cetaceum (Ph.Hg. VII.): Cetáceum (cetfaggyú)

A *Physeter macrocephalus* koponyája és gerince fölött levő üregek folyós tartalmából elkülönített és tisztított viaszanyag.

Leírás: Hófehér, gyöngyházfényű, zsíros tapintású lemezek vagy fehér granulátum, illetve fehér aprított darabok. Csaknem szagtalan, íztelen.

Oldékonyság: Vízben gyakorlatilag nem oldódik, P-alkoholban kevésbé oldódik, forró P-alkoholban mérsékelten oldódik. 90%-os alkoholban alig oldódik, forró 90%-os alkoholban mérsékelten oldódik. Zsíros és illóolajokban melegítéskor bőségesen oldódik.

Gyógyszertechnológiai vonatkozás: laurin-, mirisztin-, palmitin- és sztearinsav (C14-C18) észtereinek keveréke. Dermedéspontja 45-52°C. A kenőcsök állagát változtatja, kúpöntéskor a dermedéspontot növeli. Fedett edényben, fénytől védve tartjuk.

OLVADÁSI, ILL. DERMEDÉSI HŐMÉRSÉKLETET NÖVELŐ ANYAGOK

Alcoholum cetylstearylicum (Ph.Hg. VII): Cetil-sztearil-alkohol

Leírás: Fehér vagy sárgásfehér, zsírostapintású kristályos tömeg, vagy fehér csillogó lemezek.

Oldékonyság: Vízben gyakorlatilag nem oldódik. Alkoholban oldódik.

Jól záró edényben, fénytől védve, tartjuk.

Gyógyszertechológiai vonatkozás: A cetil-sztearil alkohol szilárd alifás alkoholok keveréke. Legalább 40% sztearil-alkoholt tartalmaz, cetil-alkohol és sztearil-alkohol tartalma legalább 90%. Olvadáspontja 49-56°C. Emulgensként használjuk kenőcsökben (O/V), HLB érték: 26. Elősegíti a gyógyszerek felszívódását is. Inkompatibilitás: erős oxidáló anyagok.

KENŐCSÖK

Ph.Hg. VII.

A kenőcsök a bőr vagy a nyálkahártya kezelésre szánt pasztikus gélek, melyek az alkotórészeket egyenletesen elosztatva oldott, emulgeált vagy szuszpendált állapotban tartalmazzák.

Egyes lágú konzisztenciájú és nagyobb víztartalmú emulziós kenőcsöket krémnek (cremor) is szoktak nevezni.

A keményebb állományú kenőcsöt, amely szilárd diszperz fázisként nagyobb mennyiségű, többnyire 40% feletti porított gyógyszeranyagot tartalmaz, pasztának nevezik.

Ph.Hg. VIII.

Nincs egységes definíció. A beviteli kapuk szerinti csoportosítások között találunk félszilárd gyógyszerkészítményeket:

- Bőrfelületre szánt/dermális félszilárd készítmények (Preparationes molles ad usum dermicum)
- Hüvelyben alkalmazott/vaginális gyógyszerkészítmények (Vaginalia)
- Fülészeti gyógyszerkészítmények (Auricularia)
- Orrüregben alkalmazott/nazális gyógyszerkészítmények (Nasalia)
- Végbélben alkalmazott/rektális gyógyszerkészítmények (Rectalia)
- Szájnyálkahártyán alkalmazott készítmények (Preparationes buccales)

KENŐCSÖK SEGÉDANYAGAI

Készítményalapok

- Szénhidrogén gélek (Vaselinum album, Unguentum simplex)
- Lipogélek (Unguentum oleosum)
- V/O típusú emulziós kenőcsök (Unguentum hydrosum, Unguentum emolliens)
- O/V típusú emulziós kenőcsök (krémek) (Unguentum hydrophilicum anioniucum, Unguentum hydrophilicum nonionicum)
- Makrogol kenőcsök (Unguentum macrogoli)
- Hidrogélek (Hydrogelum methylcellulosi)

KENŐCSÖK SEGÉDANYAGAI

A hatóanyag homogén eloszlását segítő komponensek.

- Paraffinum liquidum
- Oleum neutrale
- Glycerinum

Konzisztencia lágyítók

- Glycerinum
- Oleum neutrale
- Paraffinum liquidum

Konzisztencia szilárdítók

- Viaszok
- Paraffinum microcrystallicum
- Cera alba
- Cetacetum
- Alcoholum cetylstearylicum
- Acidum silicicum colloidal
hydrophilum

KONZISZTENCIA SZILÁRDÍTÓK

Paraffinum microcrystallicum (Ph.H g. VII.): Mikrokrisztályos paraffin

Szilárd, telített, mikrokrisztályos szénhidrogének keveréke.

Leírás: Fehér színű szemcsék. Szagtalan. íztelen.

Oldékonyság: Vízben és 90%-os alkoholban gyakorlatilag nem oldódik. Éterben, kloroformban, petroléterben és benzolban bőségesen oldódik. Olajokkal és folyékony paraffinnal melegen elegyíthető.

Eltartás: Fedett edényben tartjuk. Kenőcsök lipofil fázisa.

KENŐCSÖK SEGÉDANYAGAI

Emulgensek

Az O/V és a V/O típusú kenőcsalap emulziós rendszerének kialakításához szükségesek.

- Cholesterinum
- Cetacetum
- Alcoholum cetylstearylicum
- Lanalolum
- Natrium laurylsulfuricum
- Polysorbatum 60

EMULGENSEK

Cholesterinum. Koleszterin

Leírás: Fehér vagy gyengén sárga színű, gyöngyházfényű lapok, tűszerű kristályok, vagy kristályos por. Fény hatására sárga, vagy halványbarna színűre változik.

Oldékonyság: Vízben gyakorlatilag nem oldódik, alkoholban lassan oldódik. Acetonban, éterben, kloroformban oldódik.

Zárt edényben, fénytől védve tartjuk.

Gyógyszertechnológiai vonatkozás: V/O emulgensként használjuk. Bőrlágyító tulajdonsága van. Az előállítása történhet szintetikus úton, vagy kivonással természetes anyagokból (gyapjúviasz, tyúktojás). Jelentős mértékben képes növelni a készítményalapok vízfelvevő képességét. Nagyobb mennyiségben a bőrt izgatja, ezért a krémek legfeljebb 1-25%-ban tartalmazhatják. A koleszterines krémek előállításánál vigyázni kell, hogy a lipofil fázis hőmérséklete ne haladja meg a 100°C-ot, különben robbanásszerű gázképződés megy végbe. Inkompatibilitás: lúgos közeg, ezüst- és higany sók, jód, jodidok.

EMULGENSEK

Lanacolum (Ph.Hg. VII.): Lanalkol. Alcholes adipis lanae

Gyapjúsírból előállított koleszterin és más alkoholok keveréke.

Leírás: Sárga vagy barnássárga színű viaszszerű tömeg. Gyengén jellemző szagú. Melegítésre meglágyul, megolvad. Huzamos tárolás után felülete simává és fénylővé válik.

Oldékonyság: Vízben gyakorlatilag nem oldódik; 90%-os alkoholban kevésbé oldódik. Forró alkoholban oldódik.

Jól záró edényben, fénytől védve, hűvös helyen tartjuk. Fém edényben nem tartható! Inkompatibilitás: Savanyú közeg, lúgos közeg.

Gyógyszertechológiai vonatkozás: Emulgensként használjuk kenőcsökben. Melegítve (cseppenéspont 38-44°C) tiszta vagy csaknem tiszta sárga folyadékká olvad. Összetett lipogélek fontos összetevője. 1 g lanalkol 19 g fehér vazelinnal összeolvastva, 46 ml vizet emulgeál kenőccsé. Vaselinum cholesterinum helyett használható.

KENŐCSÖK SEGÉDANYAGAI

Beszáradást gátló anyagok

Higroszkópos sajátságukat használják ki folyadékmegtartásra.

- Glycerinum
- Egyéb poliolo

Filmképző anyagok

Koherens gélszerkezetet alakítanak ki.

- Különböző polimerek

Mikrobiológiai tartósítószer

Nagy víztartalmú kenőcsök tartósítására

- Solutio conservans