

Rektális, vaginális és intrauterin hatóanyagleadó rendszerek

2. rész

Előállítás és vizsgálat

Végbélkúpok előállítása

Öntéses vagy préseléses módon

- *fel tudjuk oldani* a hatóanyagot a kúpmassza olvadékában
- *szuszpendálni* (160 μm) vagy
- nem oldódó folyadékokat *emulgeálni*

Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



h.i.e.

Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



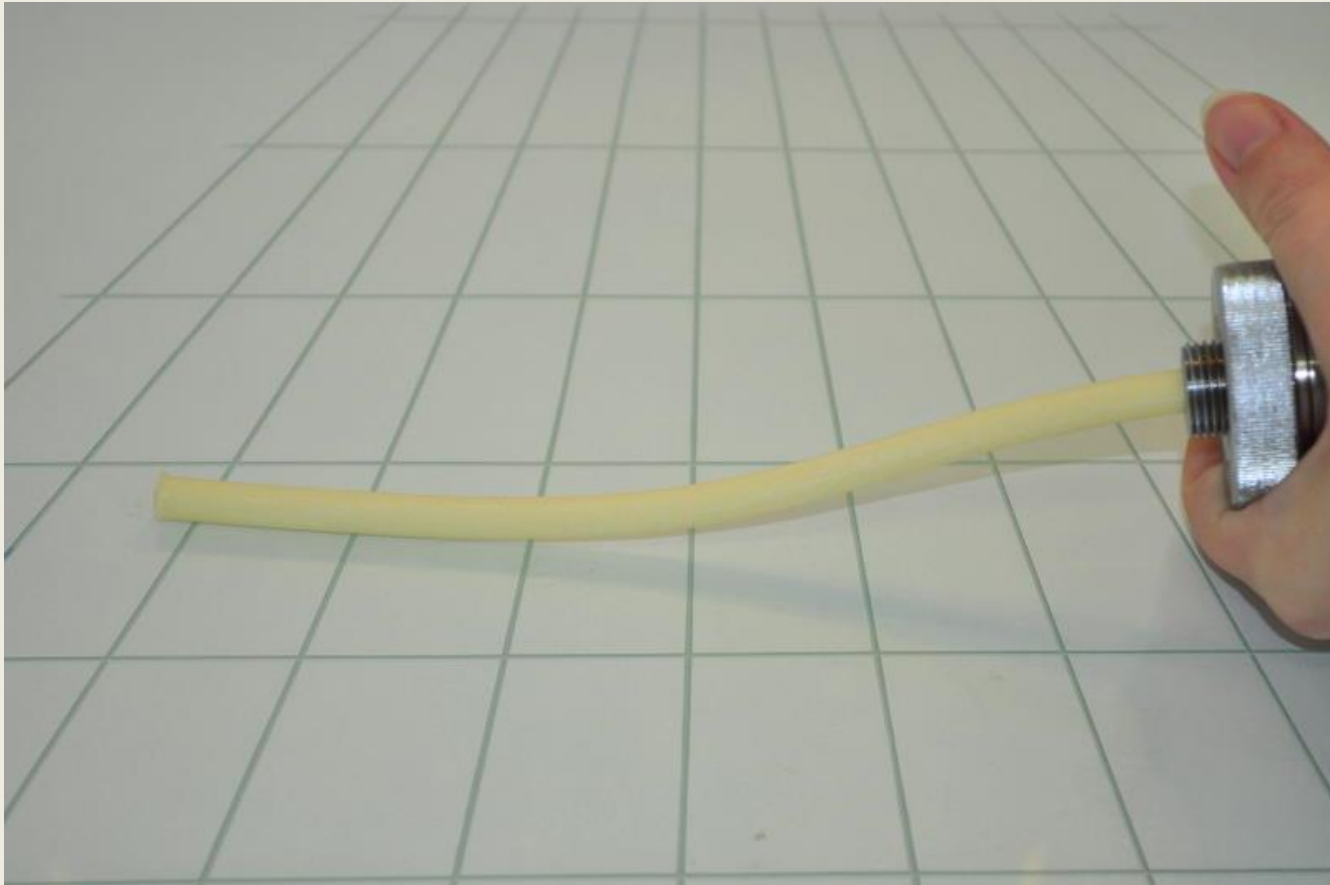
Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



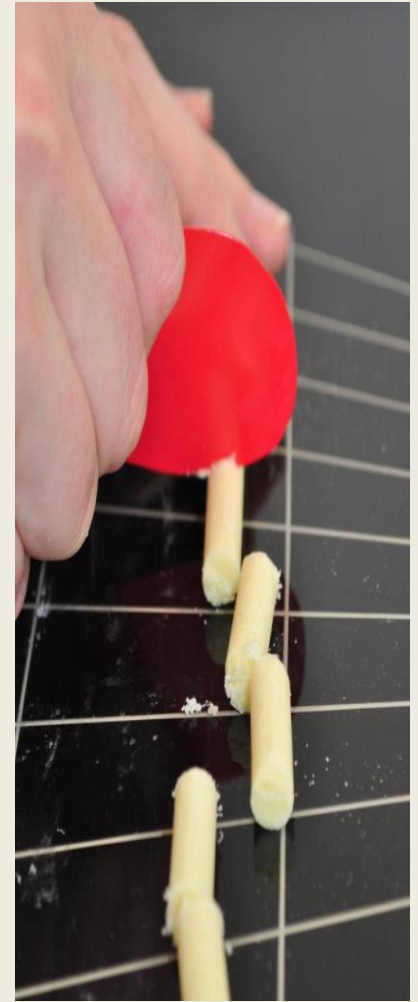
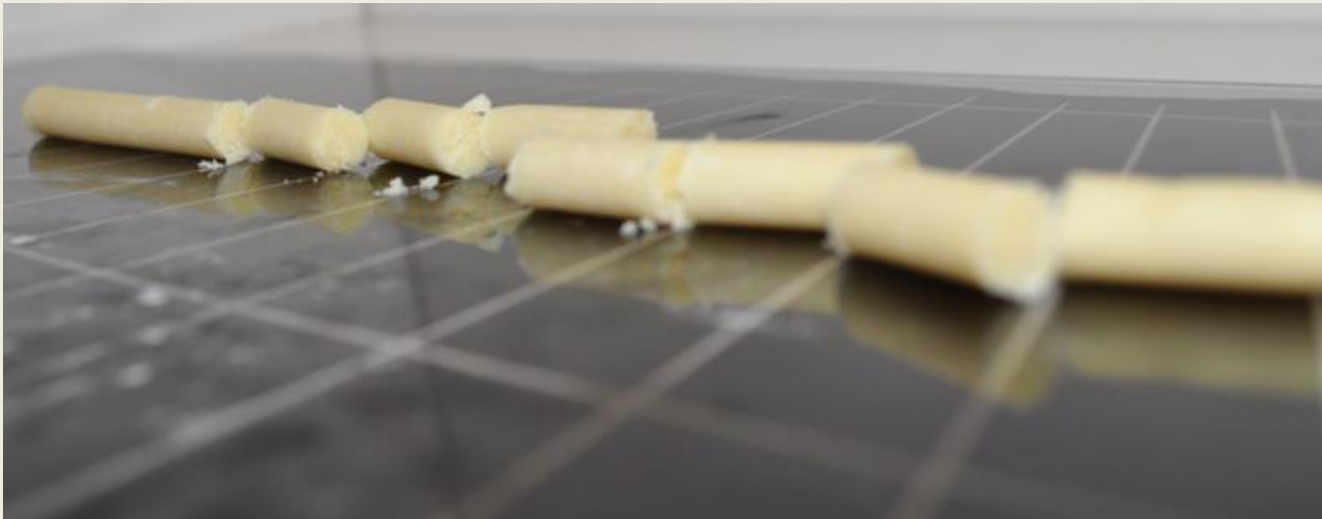
Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



Előállítás és vizsgálat

Bougie-készülékkel, préselés útján



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúp készítés



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúp készítés



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúpkészítés

$f_{\text{Metamizolum (Adeps solidus-ban)}} = 0,75$ azt jelenti, hogy a metamizol 1,00 g-ja 0,75 g szilárd zsírt szorít ki, avagy 1,00 g metamizol térfogat megegyezik 0,75 g Adeps solidus-szal.

Minden egyes komponens tömegét le kell vonni a kúpmassza tömegéből, mivel csak így biztosítható a készítményben a hatóanyag-koncentráció megfelelése.

$$T_m = O - (f_1m_1 + f_2m_2 + \dots + f_nm_n)$$

, ahol:

T_m = tota massa (a készítmény elkészítéséhez szükséges kúpmassza tömege)

O = az üres kúpforma feltöltéséhez szükséges tiszta kúpmassza tömege

f_n = az adott komponens kiszorítási faktora

m_n = az adott komponens tömege

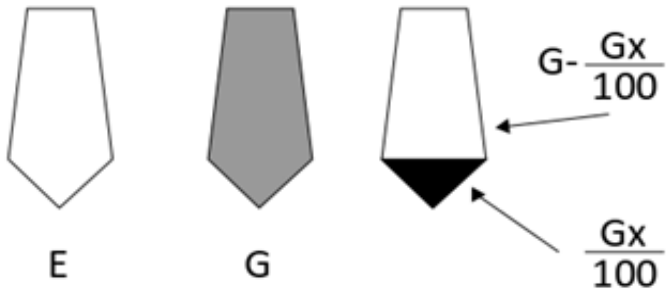
Kiszorítási faktorok

Öntéssel történő kúpkészítés

	Butyrum cacao	Adeps solidus
Barbitalum	0.81	0.72
Balsamum peruvianum	0.83	0.61
Bismuthum subgallicum	0.37	0.35
Camphora	1.49	0.98
Chloralum hydratum	0.67	0.40
Morphin. chlorat.	1.00	0.85
Metamizolum	0.88	0.75
Phenobarbital. natr.	0.84	0.62
Theophyllum	0.60	0.63
Zincum oxydatum	0,20	0.15

Kiszorítási faktor meghatározása

Determination of displacement factor (f)



$$f = \frac{E - (G - \frac{Gx}{100})}{\frac{Gx}{100}} = \frac{100(E - G)}{Gx}$$

if $\rho < 1$ than $f > 1$

if $\rho > 1$ than $f < 1$

Where:

E = mass of 1 suppository prepared from the base material only

G = mass of 1 suppository prepared with API
x = the percentage of the API in the suppository

r = density of the API

f = displacement factor

Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúpkészítés



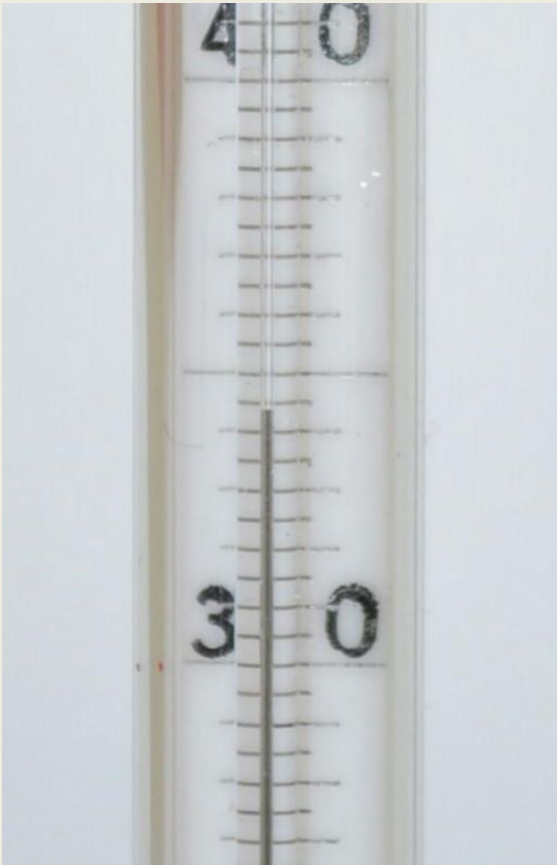
Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúp készítés



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúpkészítés



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúpkészítés



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúpkészítés



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúpkészítés



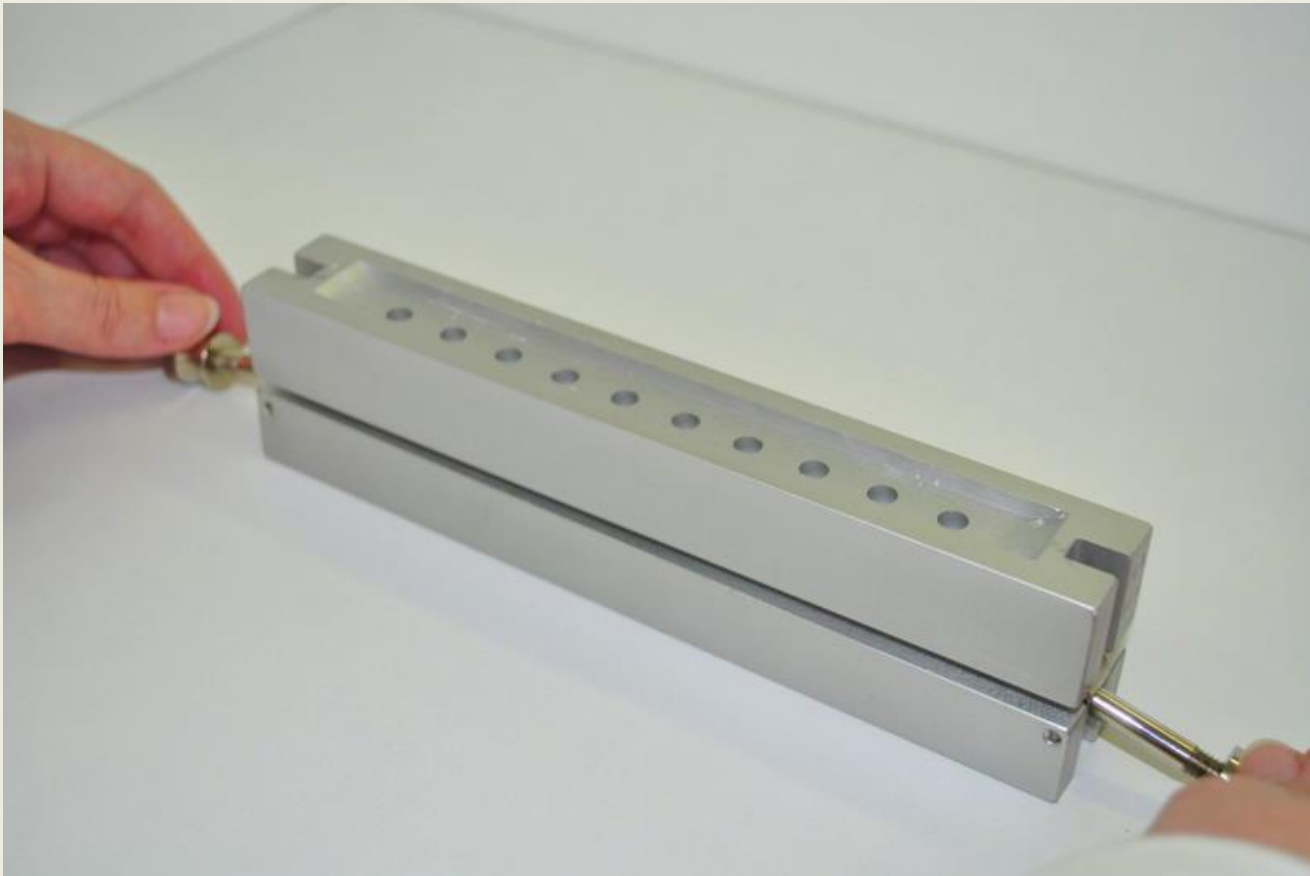
Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúpkészítés



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúp készítés



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúpkészítés



Előállítás és vizsgálat

Öntéssel történő kúpkészítés



Biofarmáciai szemlélet

- részecskeméret
- oldhatóság
- oldódási sebesség
- abszorpció
- elimináció

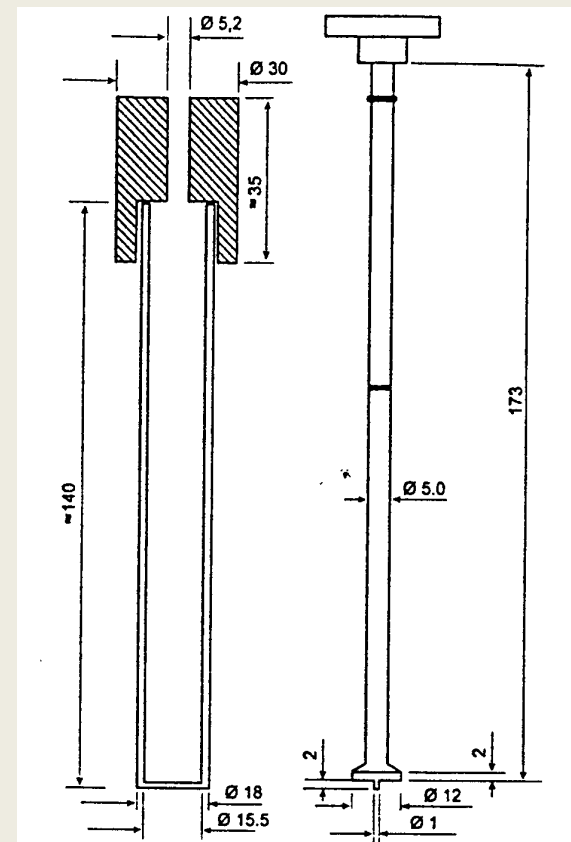
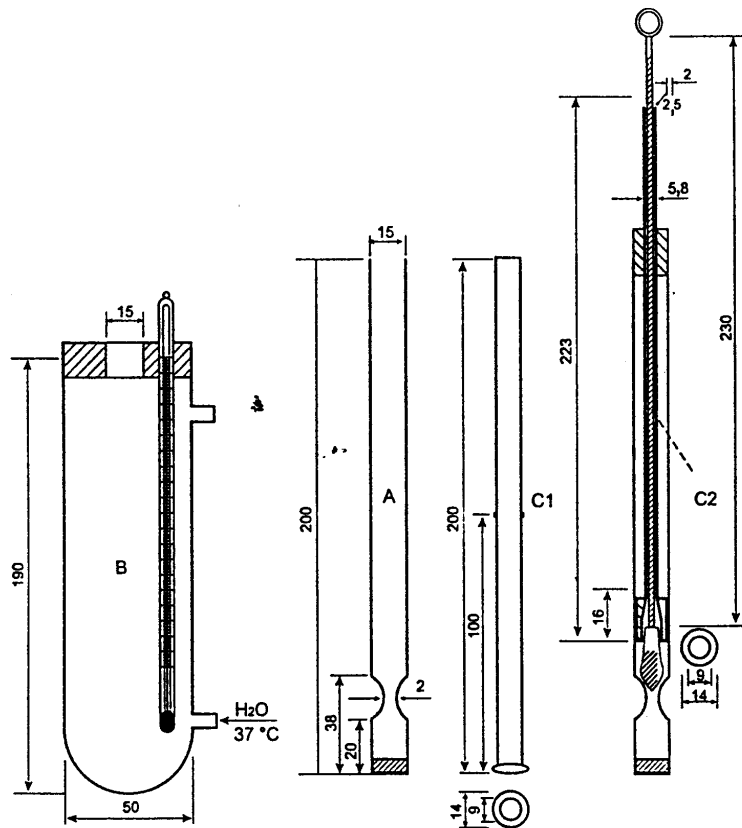
hatóanyag

- térfogat
- pH
- viszkozitás
- felületi feszültség
- biohasznosíthatóság
- idegen anyagok

készítmény

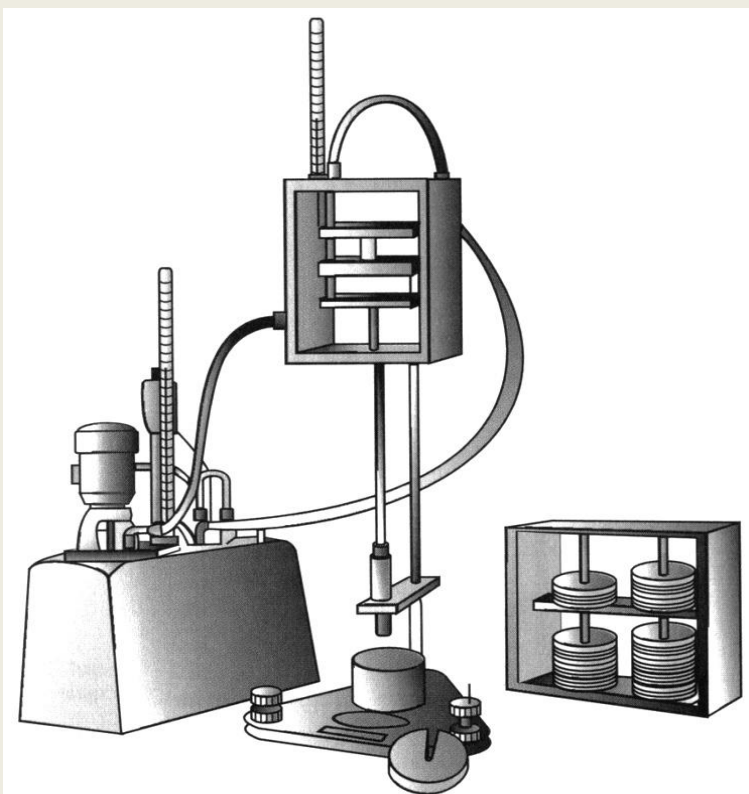
Végbél készítmények vizsgálata (Ph. Eur. 6)

Lipofil kúpok lágyulási ideje (Ph. Eur. 6)

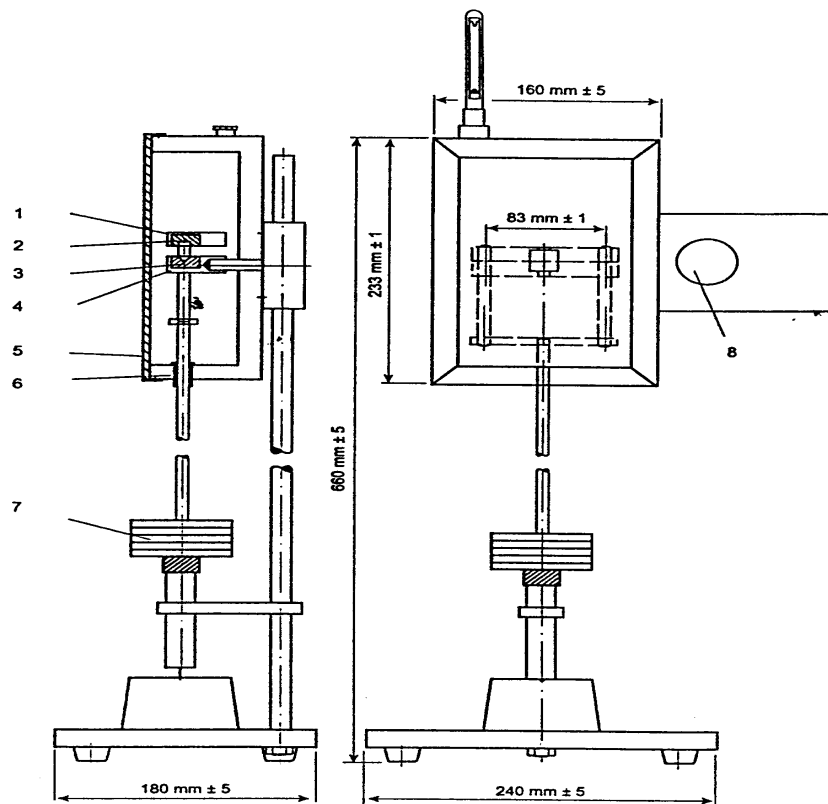


Végbélkészítmények vizsgálata

Törési szilárdság vizsgálat (Ph. Eur. 6)



Kúp törési szilárdságvizsgáló Erweka készülék



- 1: a felső törőfej hordozó szerkezete
- 2: felső törőfej
- 3: alsó törőfej
- 4: az alsó törőfej hordozó szerkezete

- 5: üveglak
- 6: temperált kamra
- 7: súlyok
- 8: hőmérséklet-szabályozó

2.9.24.-1. ábra – Készülék végbélkúpok és hüvelykúpok törési szilárdságának vizsgálatára

600 g
+ 200 g

1:00-1:20 → 600 g

1:20-1:40 → 700 g

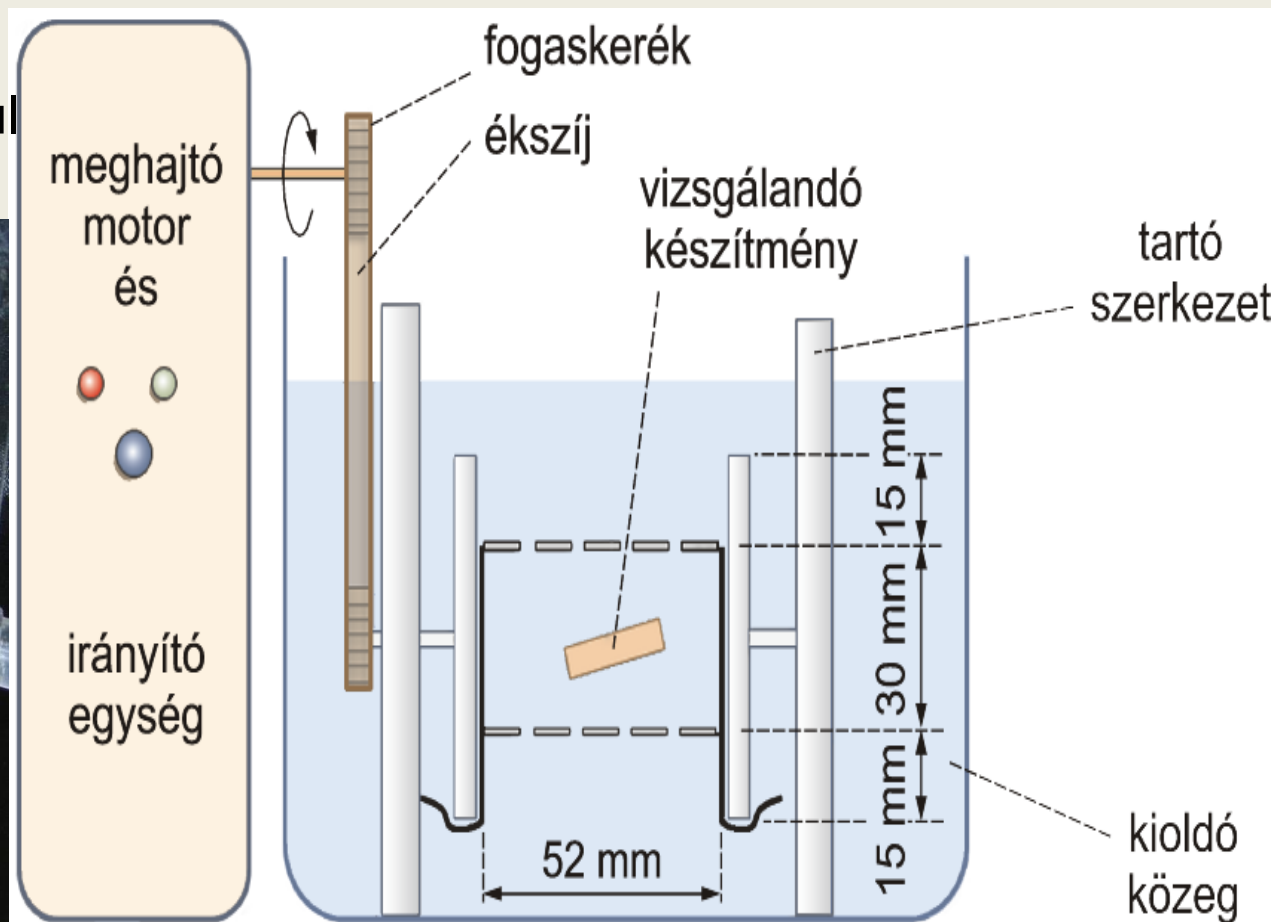
1:40-2:00 → 800 g

Végbélkészítmények vizsgálata

Szétesés vizsgálat (Ph. Eur. 6)

Lipofil készítmények: 30 min
Hidrofil készítmények: 60 min

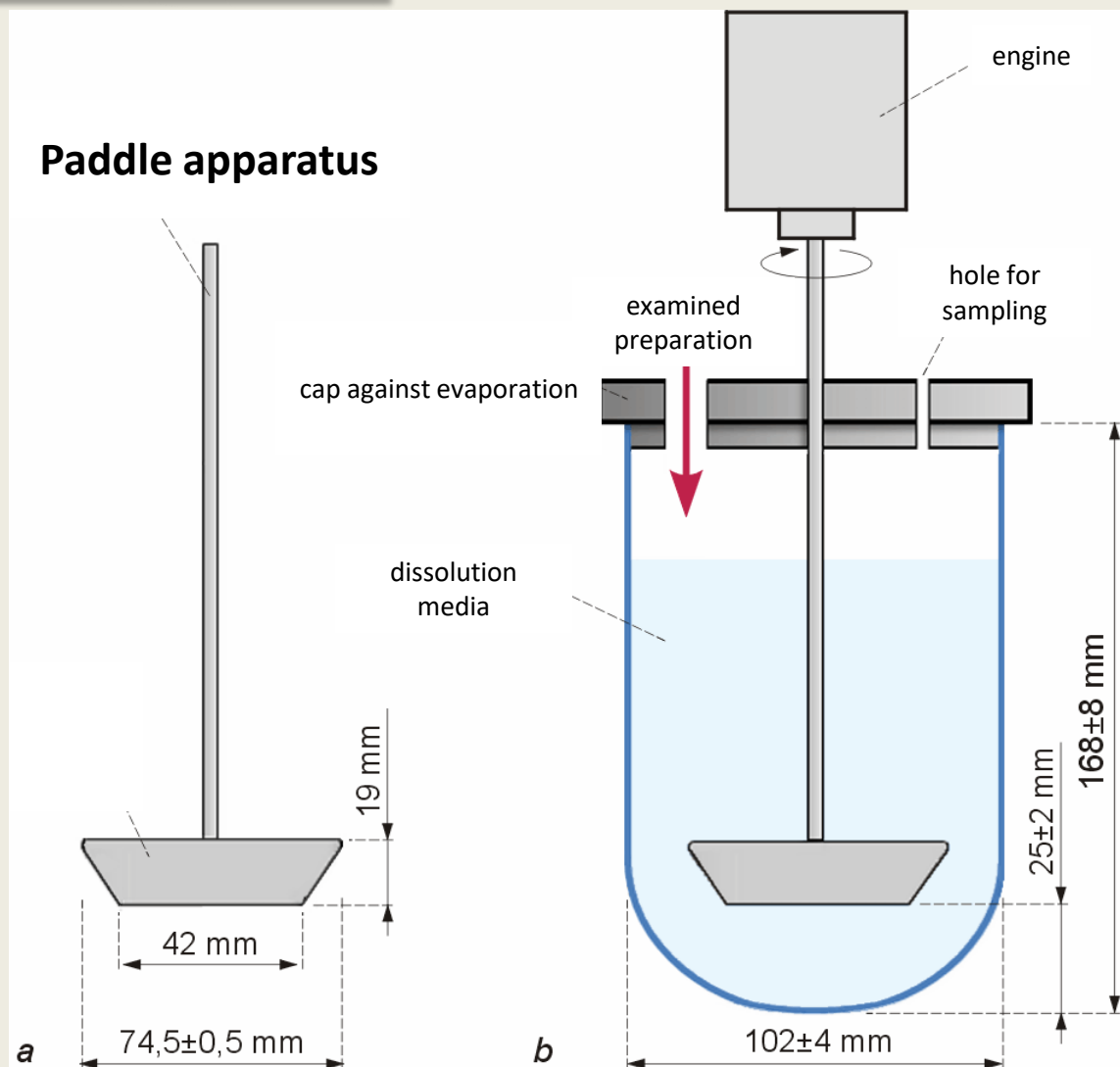
37 °C
minden 10 percben átfordul



Végbélkészítmények vizsgálata

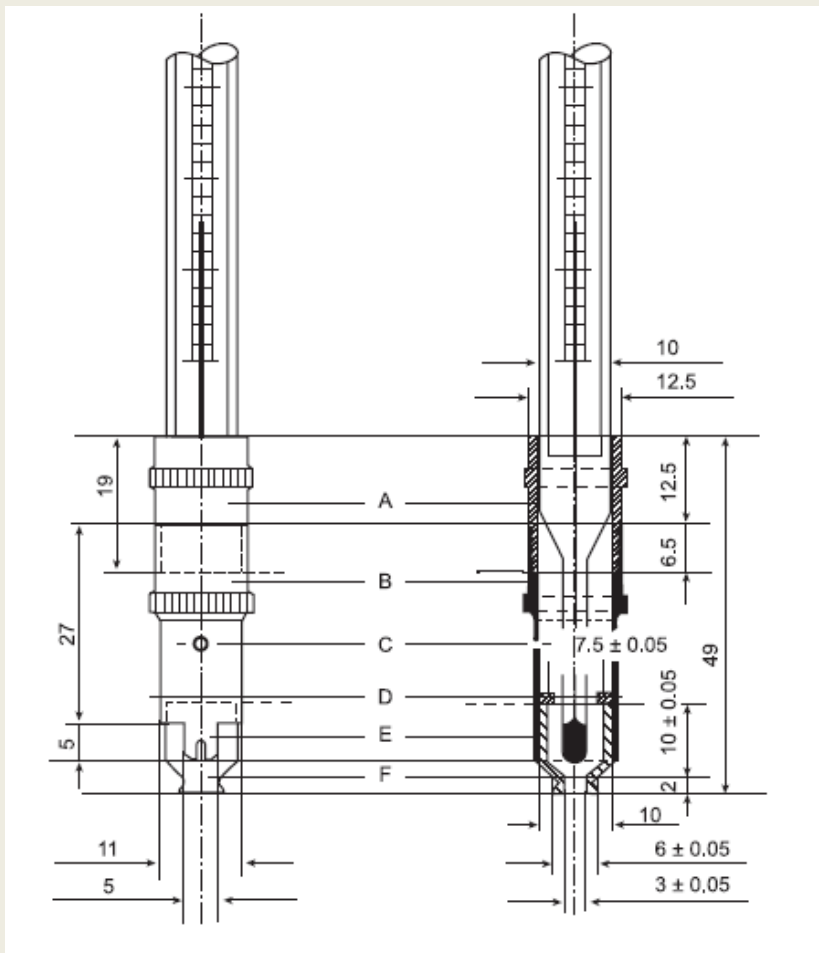
Kioldódás vizsgálat (Ph. Eur. 6)

tabletták
kapszulák
kúpok



Végbélkészítmények vizsgálata

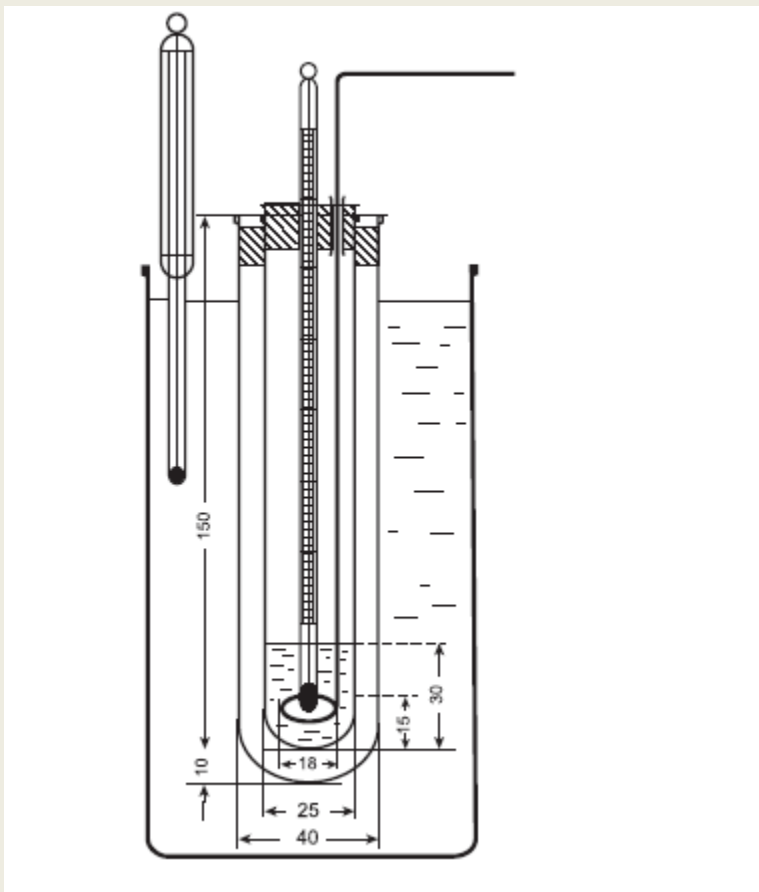
Cseppenéspont (Ph. Hg. VII)



- Ubbelohde-készülék
- hőmérsékleti érték

Végbélkészítmények vizsgálata

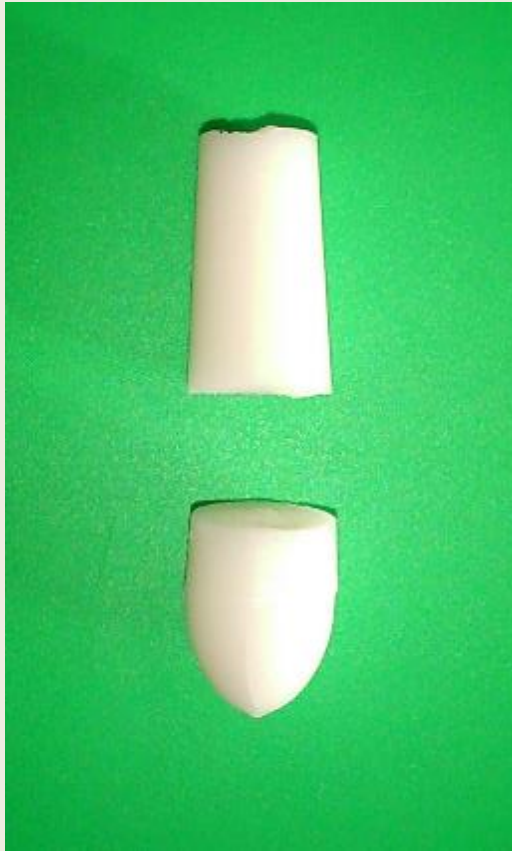
Dermedéspont (Ph. Hg. VII)



- Zsukov készülék
- hőmérsékleti érték

Végbélkészítmények vizsgálata

Szemcseméret és homogenitás vizsgálat (Ph. Hg. VII)



← Homogenitás

egyenlő tömegű részekre
felezve

Vaginális készítmények készítése és vizsgálata



Lipofil massa esetén

- 37 °C olvadjon meg
- keveredjen a vaginális folyadékkal
(magas hidroxilszám, nem-ionos felületaktív anyagok)
- gyulladás vagy bő folyás esetén!
- fogamzásgátló készítmények
- Butyrum cacao; Adeps solid. 50; Adeps solid. comp

Hidrofil massa esetén

Glicerines-zselatinos hidrogélek (vagy kúpok)

- + : gyors oldódás
- - : minőség, mikrobiológiai stabilitás, inkompatibilitás

PEG (Macrogolum) / Massa macrogoli FoNoVII.

- + : lassú szétesés, nyújtott hatás, tróposrezisztencia, jó oldószer is
- - : higroszkóposság, helyi irritáció

Habok

- Hidrofil komponens + habképző komponens.
Spermicid hatású kontraceptívumok esetén preferált.

További gyógyszerformák

Gyógyszeres rúd (pertica)

- Bőrfelület kezelésre szánt
- Pertica dithranoli FoNo VII.
- Hüvelyhenger öntőformában készül
- Ajakírek, megfelelő tartóban
- (6,0 – 10,0 g)

Húgycsőpálca (bacillus urethralis)

- Olvad, vagy oldódik a húgycsőben
- 3-5 mm x 50 mm
- Préseléssel vagy öntéssel
- (1,0 – 2,0 g)

Köszönöm a figyelmet