

## **ВЛИЯНИЕ ТИПА И КОНЦЕНТРАЦИИ ПРОЛОНГАТОРА НА ФАРМАЦЕВТИКО-ТЕХНОЛОГИЧЕСКИЕ ХАРАКТЕРИСТИКИ ТАБЛЕТОК НА ОСНОВЕ ПЕНТОКСИФИЛЛИНА**

Ряд лекарственных препаратов характеризуется измененным механизмом и характером высвобождения лекарственного вещества – это так называемые лекарственные формы пролонгированного действия. Вследствие замедления высвобождения обеспечивается увеличение продолжительности терапевтического эффекта [1].

Актуальным это является для лекарственных препаратов, содержащих пентоксифиллин.

Пентоксифиллин (3,7-дигидро-3,7-диметил-1-(5-оксогексил)-1Н-пурин-2,6-дион) – лекарственное средство, производное пурина. Улучшает микроциркуляцию и реологические свойства крови.

Положительные результаты достигаются в течение длительного курса лечения, нарушение режима приема чревато уменьшением терапевтического эффекта. Решением вопроса является разработка пролонгированных форм препарата.

Субстанция пентоксифиллина представляет собой кристаллический порошок, обладающий плохой сыпучестью и способностью слеживаться. При разработке твердой лекарственной формы пентоксифиллина пролонгированного действия необходимо введение вспомогательных веществ, которые должны обеспечивать необходимые показатели качества таблеток и таблеточных масс, такие как сыпучесть, прочность на сжатие и истирание, профиль высвобождения активного компонента.

Из-за высокого содержания в таблетке (400 мг) и низкой насыпной плотности пентоксифиллина установлено, что в качестве физического метода пролонгации для получения таблеточных масс с удовлетворительными фармацевтико-технологическими характеристиками целесообразно использовать технологию влажного гранулирования водой очищенной смеси действующего вещества с матрицеобразующим компонентом.

Для выбора матрицеобразующего компонента (пролонгатора) необходимо оценить влияние типа полимера в разных концентрациях.

В качестве объекта исследования использовали 8 вариантов опытных образцов таблеток, которые представляют собой комбинацию матрицеобразующего компонента гидроксипропилметилцеллюлозы (ГПМЦ), гидроксиэтилцеллюлозы (ГЭЦ), карбоксиметилцеллюлозы (КМЦ) и фосфатцеллюлозы (ФЦ) в двух концентрациях (35 % и 45 % от содержания активной фармацевтической субстанции) с активным компонентом – пентоксифиллином дозировкой 400 мг.

Для обеспечения необходимой массы таблетки 0,650 г в качестве наполнителя использовали микрокристаллическую целлюлозу (МКЦ) в количествах 103,5 мг (для концентрации полимера 35 %) и 63,5 мг (для концентрации полимера 45 %).

В качестве лубриканта (смазывающего вещества) использовали магния стеарат в количестве 6,5 мг для всех вариантов опытных образцов таблеток (таблица 1).

**Таблица 1 – Рецептура опытных образцов**

Наименование компонента	Количество компонента, мг в различных вариантах рецептур опытных образцов таблеток							
	1	2	3	4	5	6	7	8
Пентоксифиллин	400	400	400	400	400	400	400	400
ГЭЦ	140	180	-	-	-	-	-	-
КМЦ	-	-	140	180	-	-	-	-
ГПМЦ	-	-	-	-	140	180	-	-
ФЦ	-	-	-	-	-	-	140	180
МКЦ	103,5	63,5	103,5	63,5	103,5	63,5	103,5	63,5
Магния стеарат	6,5	6,5	6,5	6,5	6,5	6,5	6,5	6,5

Результаты определения истираемости опытных образцов таблеток представлены в таблице 2.

**Таблица 2 – Фармацевтико-технологические характеристики**

Наименование показателя	Варианты рецептур							
	1	2	3	4	5	6	7	8
Истираемость, %	0,15	0,14	0,18	0,17	0,19	0,20	0,36	0,35
	0,12	0,13	0,16	0,16	0,21	0,24	0,35	0,37
	0,13	0,12	0,15	0,16	0,19	0,23	0,38	0,40

Предварительный анализ полученных данных показывает, что тип пролонгатора оказывает большее влияние на показатель прочности таблеток на истирание, чем его концентрация.

## ЛИТЕРАТУРА

1. Леонова, М.В. Пероральные лекарственные формы с модифицируемым высвобождением / М.В. Леонова // Справочник поликлинического врача. – 2014. Вып. № 10. – С. 66-70.