

Прокопов П.Ю.

РАЗРАБОТКА ТРАНСДЕРМАЛЬНОГО ГЕЛЯ ЛОРНОКСИКАМА

Научный руководитель: канд. фарм. наук, доц. Голяк Н.С.

*Кафедра фармацевтической технологии с курсом повышения квалификации
и переподготовки*

Белорусский государственный медицинский университет, г. Минск

Актуальность. Лорноксикам — эффективный нестероидный противовоспалительный препарат класса оксикамов, применяемый для лечения острых и хронических воспалительных состояний. Однако его пероральное применение неэффективно из-за низкой растворимости в воде, интенсивного метаболизма при первом прохождении через печень и побочных эффектов со стороны желудочно-кишечного тракта. Трансдермальные системы доставки лекарственных средств обеспечивают контролируемую доставку действующих веществ через кожу в системный кровоток, позволяя обойти метаболизм в печени и обеспечивая пролонгированное высвобождение, хотя роговой слой кожи ограничивает эффективное проникновение лекарственного вещества. Они поддерживают концентрацию препарата в крови в пределах терапевтического диапазона, гарантируя, что уровень препарата не опустится ниже минимальной эффективной концентрации и не превысит минимальную токсическую дозу.

Цель: разработка трансдермального геля лорноксикама.

Материалы и методы. В качестве действующего вещества была использована субстанция лорноксикам (производитель Glenmark Life Sciences Limited, Индия). При изготовлении гелей в качестве вспомогательных веществ были использованы: Этиловый спирт, натрия гидрооксид, вода очищенная, макрогол-400, β -циклодекстрин, триметамол, пропиленгликоль, гидроксиэтилцеллюлоза (ГЭЦ), бензиловый спирт. Гель получали растворением лорноксикама или комплекса лорноксикама с β -циклодекстрином в соразтворителе или щелочном растворе воды очищенной, а затем вводили гелеобразовать ГЭЦ. Полученные гели хранили в стеклянных баночках, закрытых пластиковыми крышками в защищенном от света месте. Качество гелей оценивали по внешнему виду и количественному содержанию лорноксикама. Определяли лорноксикам спектрофотометрически при длине волны 377 нм на спектрофотометре Cary 50, в качестве растворителя и раствора сравнения использовали этанол.

Результаты и их обсуждение. Так как лорноксикам практически нерастворим в воде, получить гель без использования соразтворителей невозможно. С повышением pH среды растворимость лорноксикама увеличивается. В макроголе-400 обеспечивается полное растворение с образованием однородного геля желтого цвета. β -циклодекстрин повышает растворимость лорноксикама в воде за счёт комплексообразования, полученная смесь в дальнейшем превращается в гель при добавлении ГЭЦ. Некоторые составы гелей через 48 часов хранения изменяли цвет со светло-желтого до темно-оранжевого, что свидетельствовало о дегградации лорноксикама.

Выводы. Растворимость лорноксикама зависит от pH среды и природы растворителя, повышается в щелочных условиях, а также при использовании солюбилизаторов (макрогол-400) или за счет комплексообразования с β -циклодекстрином. Разработанные гели требуют доработки из-за нестабильности (изменение цвета).