

***5th International
Scientific
Conference
Science and
Society
London***

*5th International
Scientific
Conference
Science and
Society,
2013*

*The collection includes 5th International Scientific
Conference Science and Society*

*Held by SCIEURO in London
25-26 November 2013*

**5th International
Scientific
Conference Science
and Society**

**25-26 November
2013, London**

© SCIEURO

**5th International Scientific Conference Science
and Society ISPC 2013**

The collection includes 5th International Scientific Conference
Science and Society Held by SCIEURO in London, 21-22 October
2013

**Printed and Bound by Berforts Information Press Ltd, UK.
2013**

© **SCIEURO** 2013

All rights reserved. This work may not be translated or copied in whole or in part without the written permission of the publisher, except for brief excerpts in connection with reviews or scholarly analysis. Use in connection with any form of information storage and retrieval, electronic adaptation, computer software, or by similar or dissimilar methodology now known or hereafter developed is forbidden.

The use in this publication of trade names, trademarks, service marks, and similar terms, even if they are not identified as such, is not to be taken as an expression of opinion as to whether or not they are subject to proprietary rights.

CHEMISTRY

STUDY OF INFLUENCING DISINTEGRANT AMOUNT ON THE SOLID DISPERSION RUTIN TABLET DISINTEGRATION TIME

©Kovalsky I.V., Krasnuk I.I. (jr.), Kharitonov
U.Ya., Belyatckaya A.V., Grikh V.V.,
Lutcenko S.V., Feldman N.B., Nikulina O.I.
Russia

State Federal-Funded Educational Institution of Higher
Vocational Training I.M. Sechenov First Moscow State Medical
University of the Ministry of Health of the Russian Federation is
a full official name of the University

Abstract

Disintegrants are group of the substances using in producing tablets. It could improve the durability and decrease the disintegration time of tablets. In this research work we study how could the disintegrant quantity affects on the technological parameters of the rutin solid dispersion tablets.

Key words

disintegrants, povidon, disintegration time, solid dispersion, rutin.

Учет особенностей фармакокинетики лекарственных препаратов (биодоступность, распределение, метаболизм, скорость выведения) является одним из условий эффективного лечения. Для препаратов перорального приема важное значение имеет биодоступность лекарственного вещества. Оценка данного параметра – один из этапов, который входит в процесс совершенствования и разработки технологии получения твердых лекарственных форм.[1]

Биодоступность лекарственного вещества характеризует такие показатели, как доля вещества, всосавшегося в кровь, а также скорость появления в крови и продолжительность его там нахождения. Биодоступность определяется количеством лекарственного вещества в лекарственном препарате, которое попадает в системный кровоток в неизменном виде. На биодоступность влияет

огромное количество факторов биологического (пол, возраст, состояние систем всасывания, особенности распределения лекарственного вещества и т.д.) и фармацевтического (скорость распадаемости таблетки, количество и тип вспомогательных веществ и т.д.) характеров.[2-4]

Абсорбция лекарственного вещества зависит его от растворимости и скорости растворения. Для веществ, обладающих низкой растворимостью, на первый план выходит фактор времени, т.е. скорость растворения, так как время нахождения лекарственного вещества в ЖКТ ограничено. Как правило между биодоступностью и скоростью растворения лекарственного вещества имеется линейная зависимость, поэтому повышение растворимости и скорости растворения лекарственного вещества будет способствовать его высвобождению из лекарственной формы.[5]

Для создания таблетированной лекарственной формы твердой дисперсии рутина, в предыдущих работах были рассмотрены варианты использования различных вспомогательных веществ.[6,7] По результатам проведенных экспериментов наилучшими характеристиками обладала таблетированная лекарственная форма твердой дисперсии рутина следующего состава, представленного в табл. 1.

Таблица 1 - Технологические характеристики таблетки твердой дисперсии рутина

Состав модельной таблетки		Прочность Н	Истираемость %	Распадаемость время
Компонент	Средняя масса г			
Рутин	0,05	69,4±1,4	1,3	13 мин 24 сек
Поливинилпирролидон (ПВП)	0,1			
Лактоза	0,33			
Повидон	0,015			
Стеарат магния	0,005			
Средняя масса таблетки	0,501			

Как видно из представленных данных, изученная лекарственная форма обладает достаточной прочностью, но довольно большим показателем распадаемости. Таким образом, для изучения способности влияния количества используемого повидона на технологические характеристики таблетированной лекарственной формы твердой дисперсии рутина, были получены таблетки с различным содержанием дезинтегранта.

**5th International Scientific Conference Science
and Society ISPC 2013**

Полученные таблетки изучались по следующим показателям: прочность, истираемость, распадаемость. Результаты проведенных экспериментов, а также составы испытываемых таблеток представлены в табл.2.

Таблица 2 - Показатели качества таблеток твердой дисперсии рутинна

№	Состав модельной смеси для таблетирования на 1 таблетку		Прочность Н	Истираемость %	Распадаемость время
	Компонент	средняя масса мг			
1	Рутин ПВП Лактоза Повидон Стеарат магния Средняя масса таблетки	0,05 0,1 0,33 0,015 0,005 0,501	69,4±1,4	1,3	13 мин 24 сек
2	Рутин ПВП Лактоза Повидон Стеарат магния Средняя масса таблетки	0,05 0,1 0,325 0,02 0,005 0,502	70,8±1,2	1,2	12 мин 45 сек
3	Рутин ПВП Лактоза Повидон Стеарат магния Средняя масса таблетки	0,05 0,1 0,320 0,025 0,005 0,501	73,2±0,6	1	11 мин 04 сек

Из полученных результатов, представленных в табл. 2, можно сделать вывод, что увеличение количества повидона в таблетках влияет на распадаемость, уменьшая данное значение на 2 минуты 20 секунд. Также увеличение количества повидона увеличивает показатель прочности, что также влияет на истираемость изучаемых таблеток.

Поэтому для дальнейшего изучения была выбрана смесь вспомогательных веществ №3. Для изучения скорости высвобождения рутина из твердой лекарственной формы был проведен тест «растворение», как на полученную модельную твердую лекарственную форму, так и на заводскую лекарственную форму, представленную на Российском фармацевтическом рынке (таблетки «Аскорутин», производства ООО «РОЗФАРМ», количество рутина в исследуемой таблетке – 50мг). Результаты эксперимента представлены на рис. 1.

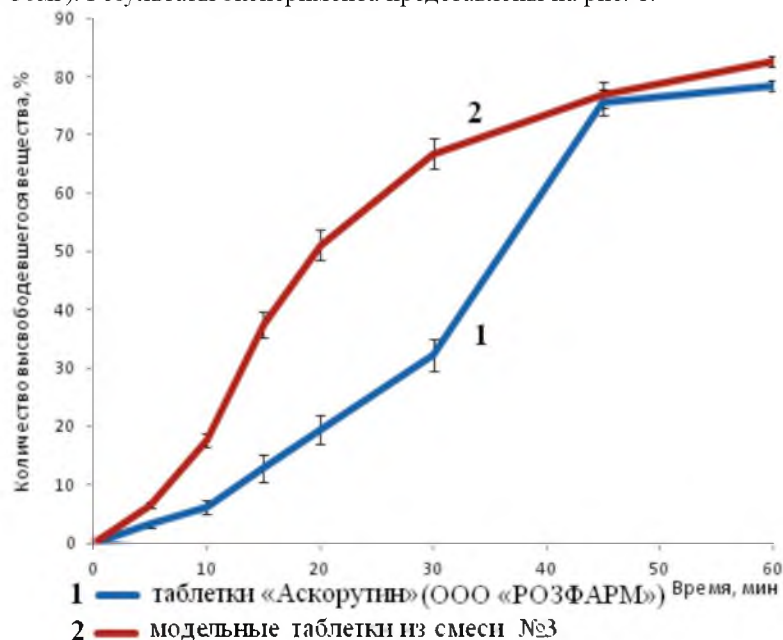


Рис. 1. Кривые высвобождения субстанции рутина из таблеток

По результатам проведенного эксперимента можно сделать вывод, что модельная таблетка, содержащая твердую дисперсию рутина, благодаря своему составу, позволяет ускорить процесс высвобождения лекарственного вещества, тем самым увеличивая его биодоступность, положительно влияя на эффективность использования данного препарата.

References:

1. Borzunov E.E., Борзунов E.E, determination of drugs bioavailability.
2. Cagareshvili G.V., technological aspects of drug bioavailability increasing from the solid dosage forms.

**5th International Scientific Conference Science
and Society ISPC 2013**

3. Chaika L.A., Medicine Чайка Л.А. Dosage forms: biopharmaceutical aspects and influencing on the drug bioavailability.
4. Murav'ev I.A. Biopharmacy like pharmaceutical technology theoretical base.
5. Tencova A.I. Modern biopharmaceutical aspects of adjuvants.
6. Kovalskiy Kovalsky I.V., Krasnuk I.I. (jr.), Kharitonov U.Ya. et al., Study of the adjuvant's influencing on the rutin solid dispersion tablets technological parameters.
7. Kovalskiy Kovalsky I.V., Krasnuk I.I. (jr.), Kharitonov U.Ya. et al., Method of adding flavanoid solid dispersions into solid dosage forms.