



РАЗРАБОТКА И ТЕХНОЛОГИЧЕСКИЕ ИССЛЕДОВАНИЯ РЕКТАЛЬНОЙ ПРОТИВОГЕМОРРОИДАЛЬНОЙ МАЗИ С ФИТОКОМПОЗИЦИЕЙ

М.А. Барсегян¹
С.Б. Евсеева²
Э.Ф. Степанова¹

¹⁾ *Пятигорская государственная фармацевтическая академия*

²⁾ *ООО «Сизмابيосинтез»*

e-mail: E.F.Stepanova@mail.ru

В статье приведены данные контент-анализа ректальных мазей, свидетельствующие о целесообразности разработки состава на базе фитокомпонентов, обладающих антисептическим, венотонизирующим, спазмолитическим и противовоспалительным действием. Обоснован состав эмульсионной мази с комплексным экстрактом календулы, мяты перечной и гамамелиса, содержащий в качестве основы гель карбопола.

Ключевые слова: ректальная мазь, комплексный экстракт, календула, мята перечная, гамамелис, геморрой.

Геморрой все еще остается одним из самых распространенных заболеваний: им страдает 10% населения планеты. Его распространенность достаточно высока и составляет 118-120 человек на 1000 взрослого населения, а удельный вес в структуре колопроктологических заболеваний – от 43 до 41%.

Показанием для консервативного лечения являются начальные стадии хронического геморроя и острое течение заболевания. Этот вид терапии складывается из общего и местного лечения, являющегося одним из основных направлений лечения больных хроническим геморроем. Однако наличие побочных действий применяемых препаратов определяет поиск новых, эффективных природных средств.

Целью наших исследований была разработка ректальной мази с фитокомпонентами.

Методы исследования: для оценки ассортимента и состава имеющихся на фармацевтическом рынке ректальных мазей для лечения геморроя использован метод контент-анализа. Для выбора оптимальной мазевой основы применялись технологические методы: термостабильность определяли методом замораживания и оттаивания. Определение термостабильности составов № 1-7 проводили, выдерживая одну серию в термостате в течение 24 часов при температуре +37°C, другую – замораживая до -20°C, затем оттаивая. Биодоступность определяли методом диффузии в гель (индикатор – хлорид железа III), осмотическую активность – методом диализа.

На первом этапе нами был проведен контент-анализ ассортимента ректальных мазей на российском фармацевтическом рынке [3]. Результаты представлены в табл. 1.

Таблица 1

Ассортимент ректальных мазей

Наименование	Состав	
	Действующие вещества	Основа
1	2	3
Гамамелис мазь, Россия, МФФ	настойка гамамелиса Д1	вазелин
Ауробин мазь, Венгрия	преднизолон капронат, лидокаина гидрохлорид, D-пантенол, триклозан	
Безорнил мазь, Китай	каламин, борнеол, искусственный безоар, жемчуг, янтарь, искусственный мускус	ланолин, вазелин, натрия тетраборат
Геморрон мазь, Канада	масло печени акулы, фенилэфрин	вазелин, вазелиновое масло
Прокто-гливенол мазь, Швейцария	трибенозид, лидокаин	парафин легкий жидкий, сорбитан сесквиолеат, сорбитол 70%, вода очищенная, изопропилпальмитат, поликос, ланолин



Окончание табл. 1

1	2	3
Проктозан мазь, Германия	буфексамак, висмута субгаллат, титана диоксид, лидокаина гидрохлорид моногидрат	воск перстяной, парафин жидкий легкий, поликос, изопропила пальмитат, сорбитана сесквиолеат, сорбитол, вода очищенная
Ультрапрокт мазь, Германия	флуокортолона гексонат, флуокортолона пивалат, цинхокаина гидрохлорид	2-октилдодеканол, касторовое масло, касторовое масло гидрированное, макрогол-400-монорицинолеат, отдушка
Постеризан мазь, Германия	инактивированные клетки кишечной палочки	ланолин, вазелин, фенол
Гепароид Лечива, Чехия	гепариноид	жидкий парафин, твёрдый парафин, цетилстеарилалкоголь, стеарин, белый воск, моноглицерид сатура лонга, алкоголь, пропиленгликоль, тропамин, метилпарабен, пропилпарабен, вода, ароматизатор
Эскулюс, Россия МФФ	настойка «эскулюс»	вазелин
Гепатромбин, Словения	гепарин, преднизолон, полидоканол	парафин твердый, парафин вязкий, ланолин безводный, кремния диоксид
Релиф, США	масло печени акулы, фенилэфрина гидрохлорид	масло минеральное, вазелин, воск, кислота бензойная, ВНА, масло кукурузное, глицерин, ланолин, спирт ланолиновый, метилпарабен, парафин, пропилпарабен, масло тимьяновое, токоферол, вода

Как следует из данных табл. 1, препараты представлены практически всеми фармакологическими группами средств, применяемых для консервативного лечения геморроя. Это венотонизирующие средства – биофлавоноиды, входящие в состав ректальных мазей прокто-гливенол, эскулюс, «гамамелис». В состав мазей гепароид лечива, гепатромбин входят антикоагулянты гепарин и гепариноиды. Представлены в составах и противовоспалительные средства – буфексамак, гидрокортизон, преднизолон, флуоцинолон ацетонид, например, препараты ультрапрокт, ауробин, гепатромбин. Местные анестетики – цинхокаин, лидокаин, тримекаин – наряду с противовоспалительными средствами входят в лекарственные препараты проктозан, гливенол, ауробин и др. Иммуностимуляторы – препараты кишечной палочки – входят в ректальную мазь постеризан.

В составе мазей представлены также компоненты, оказывающие антисептическое, вяжущее и подсушивающее действие (соединения висмута, титана, цинка, этазол натрия, триклозан). Кроме того, из таблицы видно, что применяются и ранозаживляющие средства – Д-пантенол, масло печени акулы, метилурацил, масло облепихи.

Мази с фитоконпонентами содержат, как следует из данных табл. 1, препараты следующего лекарственного растительного сырья: семян каштана конского, плодов облепихи, листьев гамамелиса, цветков календулы, корневищ аира болотного.

Что касается основ, очевидно, что используются жировые и эмульсионные основы типа масло в воде. Однако в литературе описаны ректальные мази и на гидрофильных основах (полиэтиленгликоли, гели метилцеллюлозы, натрий-карбоксиметилцеллюлозы, оксипропилметилцеллюлозы) [2].

Нами были приготовлены образцы мазей на гидрофильных и эмульсионных основах с комплексным экстрактом, содержащим гамамелис, мяту перечную и календулу. Выбор фитоконпонентов обусловлен составом и их фармакологической активностью: лекарственные препараты календулы благодаря наличию каротиноидов и флавоноидов оказывают противовоспалительное действие, экстракты гамамелиса, содержащие флавоноиды и дубильные вещества, обладают антимикробным, вяжущим и венотонизирующим действием, препараты мяты перечной используются как спазмолитические и противовоспалительные средства [3].

Содержание экстракта рассчитывали исходя из состава имеющихся зарегистрированных и запатентованных средств – свечей для лечения геморроя с фитопрепара-

тами: с настойкой гаммелиса 1:5 (Д1) и календулы гомеопатической Д1. Исходя из этого, содержание экстракта на 100 г мази должно составлять 3,5 г. Составы представлены в табл. 2.

Таблица 2

Составы ректальных мазей с комплексным экстрактом

Наименование веществ	Состав, г						
	1	2	3	4	5	6	7
Экстракт комплексный	3,5	3,5	3,5	3,5	3,5	3,5	3,5
Вазелин							60,0
Карбопол		1,0					
МЦ			3,0			3,0	
Натрий-КМЦ	2,0			2,0			
ПВС							
Вазелиновое масло				4,0	4,0	4,0	
Масло какао					4,0		
Парафин				3,0			
Глицерин	5,0	5,0	5,0	5,0	5,0	5,0	
T-2				6,0		4,0	10,0
Глицерил моностеарат					5,0		
Нипагин:нипазол (2:1)	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3
Вода	до 100	до 100	до 100	до 100	до 100	до 100	30,0

Далее были проведены исследования по изучению термостабильности мазей. Эмульсионный состав на основе натрий-КМЦ оказался нестабилен при замораживании-оттаивании и был исключен из дальнейших исследований.

Далее была исследована биодоступность разработанных образцов с помощью традиционной методики диффузии в гель (индикатор – 3% раствор хлорида железа (III)). Степень высвобождения препарата из лекарственной формы оценивали по диаметру окрашенной зоны (синяя окраска). Результаты представлены на рисунке.

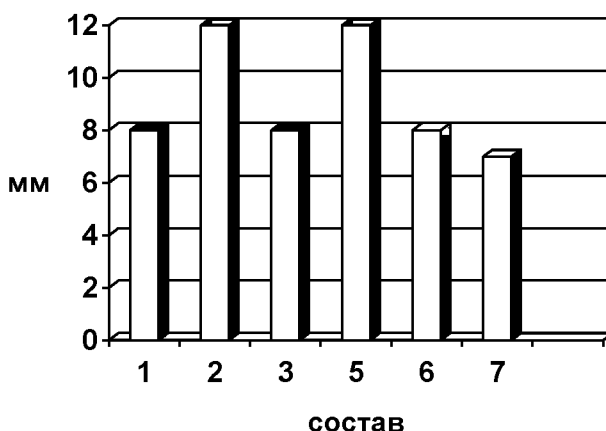


Рис. Результаты высвобождения полифенольных веществ из мазей

Как видно из рисунка, образцы геля и эмульсионной мази на основе карбопола обладают одинаковой биодоступностью. Для снятия воспаления и отека имеет значения такой технологический параметр как осмотическая активность. Осмотическую активность определяли методом диализа по Кривчинскому [1]. Осмотическая активность образца геля составила 570% через 24 часа, а эмульсионного состава 790%, поэтому последний был выбран как оптимальный.

Таким образом, разработан состав ректальной мази с экстрактом календулы, мяты и гаммелиса на эмульсионной основе, содержащий гель карбопола, вазелиновое масло и масло какао и эмульгатор базовый (глицерил моностеарат).



Литература

1. Гунько, В.А. Изучение осмотической активности некоторых мазевых основ / В.А. Гунько, А.А. Гунько, Н.М. Мушенко // Хим.-фармац. журн. – 1982. – Т.16, №3. – С. 89-91.
2. Чуешов, В.И. Промышленная технология лекарств: учебник : в 2 т. Т. 2 / В.И. Чуешов [и др.]. – Х.: МТК – Книга : Изд-во НФАУ, 2002. – 716 с.
3. Электронная версия Государственного Реестра ЛС [Электронный ресурс]. Электрон. дан. – М., 2010. – Web: <http://www.drugreg.ru>. – Загл. с экрана.

THE DEVELOPMENT AND TECHNOLOGICAL RESEARCH OF RECTAL OINTMENT WITH COMPLEX HERBAL EXTRACT

M.A. Barsegyan
S. B. Yevseyeva
E. Ph. Stepanova

*Pyatigorsk State
Pharmaceutical Academy*

e-mail: E.F.Stepanova@mail.ru

The results of content-analysis of rectal ointments in this article are represented. The results of technological research of rectal ointment with complex herbal extract with gamamelis, calendula and menthe are represented. Requested to formulate herbal remedies – on the basis of complex extract with wound healing activity, antibacterial, venotonic and spasmolytic activity.

Key words: rectal ointments, extract, gamamelis, calendula and menthe.