

Детские и гериатрические лекарственные формы. Особенности их технологии и выпуска



*Лектор: Торланова Б.О., к.фарм.н., зав.
каф. ТФП*

Детские лекарственные формы

Проблему создания детских лекарственных форм обостряют следующие факторы:

- **особая роль лек.формы;**
- **пути введения лекарств, т.к. это напрямую связано с особенностями детского организма;**
- **правильный расчет доз препарата с учетом возраста и пути введения.**

Развивающийся организм живет совсем по другим законам, чем взрослый; причем каждый возрастной период (грудной, дошкольный, школьный) имеет свои особенности как физиологические, так и психо-эмоциональные.



Детские лекарственные формы

Общие особенности детского организма:

- В детском возрасте повышен обмен веществ, поэтому всасывание ЛВ у них происходит быстрее и полнее, чем у взрослых;
- Маленькая масса отдельных жизненно важных органов;
- Особенности биохимических реакций в детском организме связаны с тем, что еще не все внутренние органы и железы включились в выполнение своих функций;
- Качественный и количественный состав ферментов слюны и пищеварительных соков, ферментов печени и поджелудочной железы существенно отличаются от взрослого организма, поэтому по-разному проходит метаболизм лек. веществ во внутренних средах и клетках различных тканей детского организма;
- Риск возникновения аллергических, иммунных и других реакций организма намного выше;
- Дети по своему психо-эмоциональному состоянию (особенно часто болеющие дети) по-разному реагируют на боль. В некоторых случаях отрицательная реакция на боль может свести на нет терапевтическое действие лекарства.
- Дети по-особенному реагируют на вкус, запах и даже цвет лекарства, н-р, лекарства без вкуса и запаха ихстораживают;
- Необходим точный расчет разовых доз детских лекарств и число их приемов.

Детские лекарственные формы

С учетом физиологических и психо-эмоциональных особенностей детского организма в педиатрической практике наиболее широко применяются следующие виды лек.форм:

- Жидкие пероральные (растворы, эмульсии, суспензии, микстуры, сиропы, ароматные воды, капли);
- Ректальные (суппозитории, клизмы, ректиолы, ректальные мази);
- Твердые пероральные (таблетки, драже, капсулы, пилюли, пастилки и др);
- Наружные (пластыри, аэрозоли, спиртовые растворы);
- Аэрозоли ингаляционные и наружные.
- Реже парентеральные ЛФ.



Преимущества пероральных растворов

- (1) Легко проглатываются, следовательно удобны для детей и пожилых.
- (2) Более быстро действуют по сравнению с таблетками и капсулами.
- (3) Гомогенны, следовательно ЛВ более однородно распределено.
- (4) Уменьшают раздражающий эффект некоторых ЛВ (aspirin, KI, KBr в форме таблеток) и минимизируют побочное действие в ЖКТ, таких ЛВ, как KCl (в таблетках).

Недостатки

- (1) Занимают много места, следовательно создают трудности при транспортировке и хранении.
- (2) Неприятный вкус и запах труден для маскировки.
- (3) Необходимость в дозаторах для отмеривания дозы (ложка и т.п.).
- (4) Менее стабильны, чем твердые формы.

Главные признаки нестабильности:
изменение цвета, образование осадка, газа, рост микроорганизмов.



Детские лекарственные формы

Жидкие лек формы обладают рядом недостатков:

- **Возникает проблема микробной устойчивости микстур, ароматных вод, сиропов, водных растворов, настоев и т.д.;**
- **Возникает проблема агрегативной устойчивости эмульсий и суспензий;**
- **Возникает проблема стабильности лек. веществ при хранении.**

Эти недостатки могут быть устранены в лекарствах для взрослых введением консервантов, эмульгаторов, стабилизаторов, антиоксидантов, ПАВ и т.д., что однако нежелательно в детских ЛФ, т.к. они (вспомогательные вещества), к сожалению, неиндифферентны, особенно по отношению к детскому организму.

Устранимым недостатком является часто в жидких ЛФ запах и вкус. Для этого применяют корригенты запаха (эфирные масла, пахучие вещества - ментол, анитол и др.) и вкуса (сиропы, эссенции и др.: NaCl, лимонная кислота).

Несмотря на эти недостатки жидкие ЛФ в детской практике предпочтительней, чем таблетки, капсулы, драже и т.д., так как их легче дозировать в зависимости от возраста (по количеству капель или мл, ложками чайными, десертными, столовыми, а также специальными ложками-дозаторами, насадками-капельницами и т.п.).

Подсластители

- **Сахароза** – наиболее широко используется. Достоинства: Бесцветна, хорошо растворима в воде, стабильна в диапазоне pH 4-8, повышает вязкость, маскирует соленый и горький вкус, обладает успокаивающим эффектом на больное горло.
- **Многоатомные спирты** (sorbitol, mannitol and glycerol) обладают сладким вкусом и могут применяться для противодиабетических препаратов.

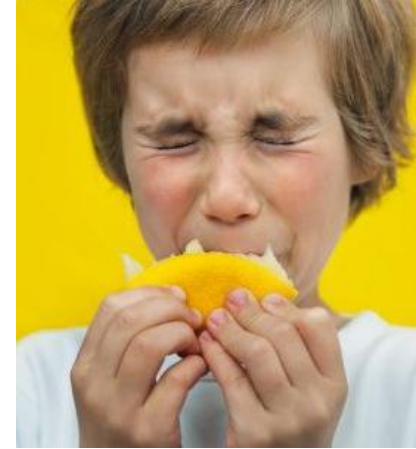
Сравнение подсластителей

	Относительная сладость, %*)	Растворимость в воде, % m (25 ⁰ C)
Сахароза	100	67
Сорбит	60	70
Маннит	50	18
Лактоза	20	19

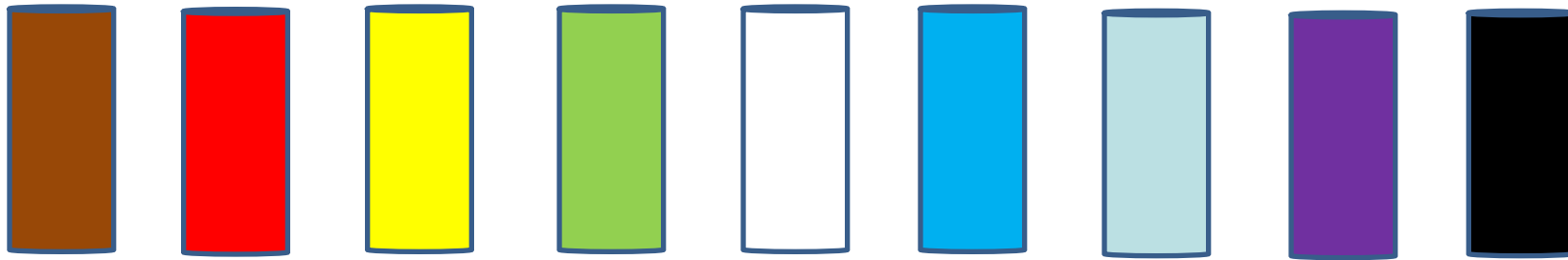


Ароматические и вкусовые добавки

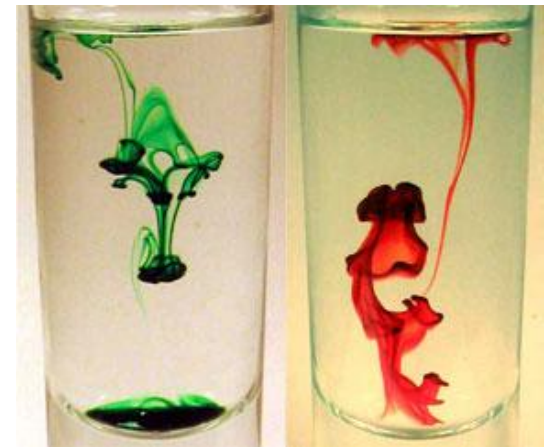
- * Маскируют неприятный вкус и запах.
- * Позволяют легко идентифицировать продукт.
- * Используются природные вещества: природные соки и ароматические (эфирные) масла (мята, лимон)
- * Искусственные ароматизаторы – они более дешевы, доступны и стабильны.



Красители



Цвет и прозрачность



Детские лекарственные формы

Сами лекарственные препараты, применяемые в детской практике, делятся на три группы:

- Препараты общеукрепляющего действия (витамины, микроэлементы);**
- Препараты для лечения детских болезней (ветрянка - р-р фукокорцина и др.);**
- Препараты, не назначаемые детям или применяемые в исключительных случаях только в стационарах (гипотензивные, наркотические, снотворные и др.), т.к. возможно появление нежелательных, иногда опасных эффектов.**

Детские лекарственные формы

Создание детских ЛФ идет по 2 направлениям:

- **Создание ЛФ - заменителей инъекций.**
- **Разработка ЛФ с улучшенным вкусом.**

Для замены инъекций предлагаются:

- **Суппозитории с препаратами резорбтивного действия (жаропонижающие, с сульфаниламидами, противовоспалительные, антиаггративные, для предоперационной премедикации, и др.);**
- **Аэрозоли ингаляционные и наружные, пластыри эндерматические и диадерматические;**
- **Ректальные лекарственные клизмы, ректиолы;**
- **Капсулы.**



Детские лекарственные формы

Разработка ЛФ с улучшенным вкусом включает:

- Маскировку неприятных вкуса и запаха за счет:
- Нанесение покрытий (пленок) на таблетки;
- Заключение лекарства в капсулы, однако для детей раннего возраста нежелательно использовать в лекарствах оболочек, препятствующих непосредственному контакту вкусовых и обонятельных рецепторов с молекулами ЛВ, т. к. лекарства без запаха и вкуса их настораживают и даже иногда вызывают отрицательные эмоции.
- Использование ВМС в жидких лек. формах, молекулы ВМС обволакивают лек. вещество, а также вкусовые рецепторы и не дают почувствовать вкус лекарство. В качестве ВМС используют слизи, камеди, альгиновую кислоту, альгинат Na, производные целлюлозы и др. вещества, повышающие вязкость раствора.
- Улучшение неприятных вкуса и запаха за счет добавления: эфирных масел (мятного, лимонного, эвкалиптового и др.); сиропов (простой сахарный, вишневый и др. фруктово-ягодные); эссенции - дюшес, цитраль; кристаллических веществ: глюкоза, NaCl, ксилит, сорбит; пахучих веществ: ментол, анитол и др.

Детские лекарственные формы

Особое значение в детской практике имеют:

- **Правильный расчет доз и числа приемов лекарства;**
- **Создание таких упаковок, которые имели предохранения от их вскрытия детьми;**
- **Щадящий путь введения лекарства в организм.**



Гериатрические лекарственные формы

Также, как и детский, стареющий организм имеет свои физиологические и психо-эмоциональные особенности, что служит основанием для выделения гериатрических лекарственных средств в отдельную группу.

Проведение оптимальной фармакотерапии у больных пожилого (65-75 лет) и старческого (75-85 лет) возраста возможно только при учете физиологических особенностей организма, характерных для стареющего организма.

При этом предусмотрены следующие мероприятия:

- Специфичное дозирование лекарства с учетом возраста и сопутствующих хронических заболеваний;**
- Обеспечение щадящего способа применения лекарства;**
- Предупреждение передозировки и ошибки в приеме.**

Гериатрические лекарственные формы

- В стареющем организме возникают структурные, метаболические, функциональные изменения, происходящие на системном органном, клеточном, молекулярном уровнях.**
- С возрастом уменьшается вес жизненно важных органов: печени, сердца, мозга. Одновременно изменяется форма их клеточных структур и состав клеточной жидкости.**
- Меняется также состав тканей организма. Так, к 60-и годам уменьшается почти на 20% мышечная масса тела, на 10-15% снижается количество воды в организме, в то же время количество жиров (липидная масса) увеличивается на 10-20%. Снижается ударный и минутный объем сердца, повышается артериальное и снижается венозное давление.**
- С возрастом ослабляется функциональная активность почек, желчного пузыря, снижается секреция слюнных желез, слизистой ЖКТ, меняется ферментный состав пищеварительных соков и микрофлора толстой кишки, истощаются железы, продуцирующие гормоны (н-р, инсулярный аппарат). Т.о., резко снижается обмен веществ, нарушены процессы всасывания и метаболизма (биотрансформации) не только в ЖКТ, но и во всем организме.**
- В психо-эмоциональной сфере также происходят изменения, т.к. снижается функциональная активность вегетативной нервной системы, что ведет к понижению адаптационной способности организма. Лица пожилого и старческого возраста более выражено реагируют на боль, неприятные органолептические свойства лекарства, забывают вовремя принимать лекарства, особенно в вечернее и ночное время.**

Гериатрические лекарственные формы

Таким образом, психо-эмоциональные, физиологические и патологические изменения стареющего организма влияют существенным образом на характер действия лекарства у больных пожилого и старческого возраста. Эти изменения могут вызвать ряд нежелательных побочных эффектов:

- Кумуляцию препаратов в организме вследствие медленного метаболизма и элиминации, а также вследствие отсутствия необходимых для метаболизма ферментов (скрытая ферментопатия);**
- Развитие стойкой повышенной чувствительности к лек. веществам; особенно вследствие их длительного применения ранее;**
- Опасное взаимодействие между лекарствами при лечении основного и сопутствующих заболеваний;**
- Развитие отрицательного эмоционального фона при болезненных путях введения лекарства;**
- Нарушение курса лечения при забывчивости и нерегулярном приеме лекарства, что особенно опасно при лечении инфекционных заболеваний, т.к. это приводит к появлению резистентных форм микроорганизмов и т.д.**

Гериатрические лекарственные формы

Лекарственные препараты, используемые в современной геронтологии (гериатрии), (геропротекторы) делятся на 3 группы.

- Группа «А» - геропротекторы - препараты и их комбинации, оказывающие общестимулирующее действие на стареющий организм; направленные на нормализацию нарушений обменных процессов и функций; тонизирующие нервную систему и повышающие ее трофическую функцию.**
- Группа «Б» - это препараты, наиболее часто применяемые в гериатрической практике при различных заболеваниях, характерных для этого возраста.**
- Группа «В» - это лекарства, применение которых опасно для лиц пожилого и старческого возраста и которые наиболее вероятно вызывают нежелательные побочные эффекты, иногда опасные для этого возраста. Т.е., это препараты, прописывание которых имеет возрастные ограничения. Могут применяться только в стационаре под наблюдением врача.**

Гериатрические лекарственные формы

К наиболее предпочтительным видам ЛФ, применяемым в гериатрии, относятся:

- Наружные (натирания, мази, линименты, пластыри);
- Ректальные (лечебные клизмы, суппозитории, ректальные мази);
- Пероральные (микстуры, сиропы, капсулы)
- Ингаляционные ЛФ (аэрозоли)



Гериатрические лекарственные формы

При лечении лиц пожилого и старческого возраста важное значение имеют:

- Правильный выбор препарата;**
- Правильный выбор вида ЛФ и пути ее введения в организм;**
- Правильный расчет доз и числа приемов.**



Гериатрические лекарственные формы

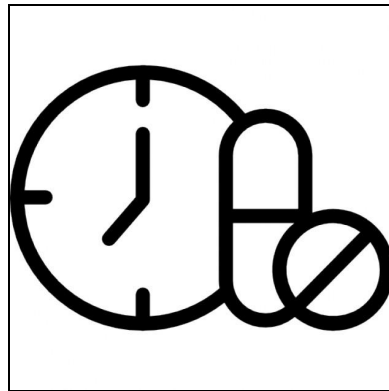
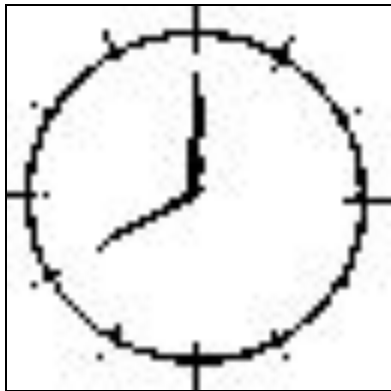
Сами упаковки с лекарством, их оформление должны предусматривать профилактические (предупреждающие ошибки приема и дозирования) мероприятия и устройства. К ним относятся:

- **Предупреждающие этикетки;**
- **Пиктограммы;**
- **Диспансеры «Dose_t P».**
- **Разъяснительные листки- вкладыши.**

В качестве предупреждающих этикеток используются дополнительные этикетки: Н-р, о том, что после приема аминазина, апрессина, камфония, клофелина, редергина и т.п. препаратов во избежание ортостатического коллапса необходимо полежать не менее 1,5 часа; что нельзя применять многие противокашлевые препараты (н-р, содержащие наркотические - эфедрина г/хл.- и ненаркотические вещества) во время работы, требующей повышенного внимания.

Пиктограммы необходимы пожилым людям, т.к. обычно они получают сразу несколько лек. средств в аптеке и не в состоянии запомнить все наставления фармацевта (пить до еды или после, за сколько минут и т.д.) Красочно оформленные цветные рисунки - пиктограммы с указанием времени приема, характерных особенностей приема позволяют предотвратить ошибки и обеспечить максимальный терапевтический эффект.






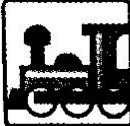




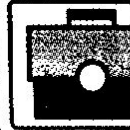




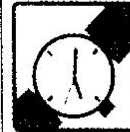




Пиктограммы



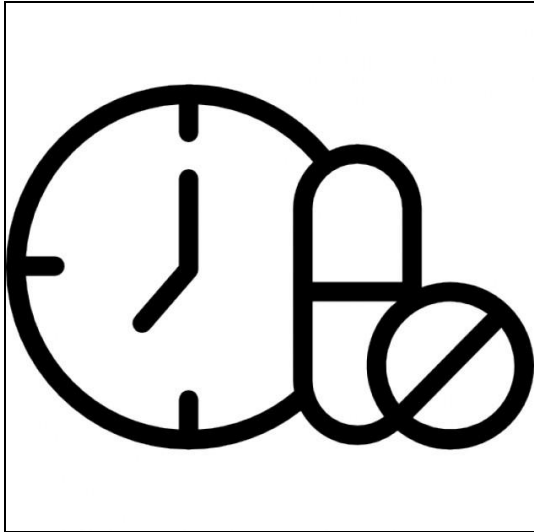
Сирдалуд

4 мг⊕⊕

2 мг⊕

	ЭФФЕРАЛГАН педиатрический раствор	ЭФФЕРАЛГАН свечн	ЭФФЕРАЛГАН порошки	ЭФФЕРАЛГАН шипучая форма
ГРУДНЫЕ ДЕТИ 	75 мг 	80 мг 	80 мг 	
МАЛЕНЬКИЕ ДЕТИ 	150 мг 	150 мг 	150 мг 	
ДЕТИ 	300 мг 	300 мг 		330 мг 
ВЗРОСЛЫЕ 		600 мг 		660 мг 

Диспансеры типа «Dozet P»



Благодарю за внимание!

