

# 1.Félév

## 6. Szeminárium

Dr. Varga Balázs

DE ÁOK Farmakológia és Farmakoterápia tanszék

# 11-12-es Tétel

11.

- ▶ A klírensz (clearance) és tulajdonságai
- ▶ Szelektív  $\alpha$ -szimpatolitikumok
- ▶ A máj és epeutak betegségeiben használatos farmakonok
- ▶ Szemcseppek

12.

- ▶ Gyógyszerek plazmakoncentrációja ismételt adagolás után. Telítő és fenntartó adag
- ▶ Katekolaminok metabolizmusa és farmakológiai befolyásolása
- ▶ Asthma bronchiale gyógyszerei
- ▶ Belső használatra szánt folyékony gyógyszerformák 1: Kanalas orvosság

# A vese clearance (klírensz)

- ▶ Def.: az a plazma térfogat amely egységnyi idő alatt megtisztul a gyógyszertől a vese által
- ▶ Az urea vagy méginkább a kreatinin clearance a vese funkcionális állapotának rutin klinikai mércéje, utóbbi még jobban tükrözi a glomerulus filtrációs rátát.

$$CL_r = \frac{C_u \times V_u}{C_p}$$

$C_u$  = vizeletbeni koncentráció

$V_u$  = vizelet áramlási sebesség (percdiuresis)  
(mértékegysége térfogat/idő (pl. ml/perc vagy ml/perc/kg))

$C_p$  = plazma koncentráció  
(a koncentráció mértékegységei kiesnek)

- ▶  $CL_r$  tág határok között mozog az egyes gyógyszerek esetén:
  - ▶ kevesebb, mint 1 ml/perc-től 700 ml/perc-ig

Elméleti maximum  
(a vese vérátáramlása szab határt)

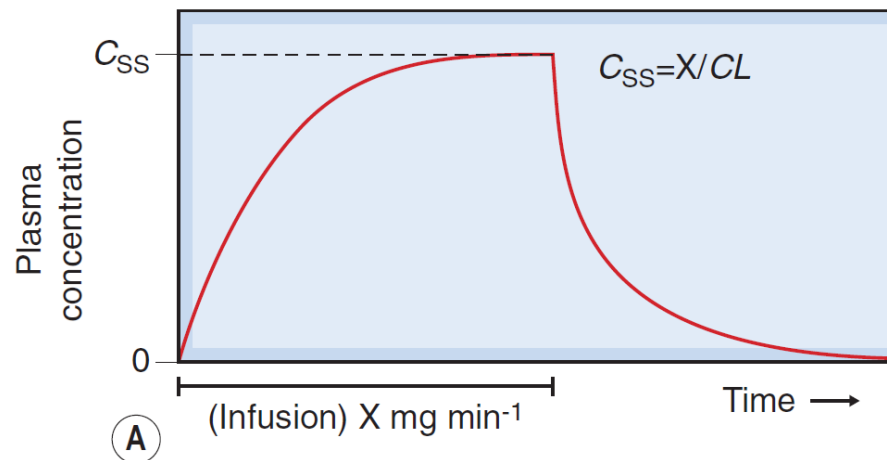
# A Totál Clearance

- ▶ Def.: az a plazma térfogat amely egységnyi idő alatt megtisztul a gyógyszertől minden lehetséges eliminációs úton
- ▶  $CL_{\text{tot}} = CL_r + CL_{\text{met}} + CL_{\text{légzés}} + CL_{\text{faeces}} + CL_{\dots}$  stb.
- ▶ A totál clearance kiszámolható.  
A gyógyszerkoncentráció el kell érje a *steady state* állapotot
  - ▶ *Steady state* = a bevitel mértéke megegyezik az elimináció mértékével
  - ▶ Állandó sebességű i.v. infúziót kell alkalmazni (amely tegyük fel X mg gyógyszert adagol óránként)
  - ▶ A steady state plazma koncentrációt ( $C_{ss}$ ) kell mérni
  - ▶ Ekkor:

$$X = C_{ss} \times CL_{\text{tot}}$$

↓

$$CL_{\text{tot}} = \frac{X}{C_{ss}}$$



# A Totál Clearance

- ▶ Def.: az a plazma térfogat amely egységnyi idő alatt megtisztul a gyógyszertől minden lehetséges eliminációs úton
- ▶ Másik számítási mód a definícióból adódik:
- ▶  $CL_{\text{tot}} = k_{\text{el}} V$  (vagy  $CL_{\text{tot}} = k_{\text{el}} V_d$ )
- ▶  $K_{\text{el}}$  = eliminációs konstans (mértékegység:  $\text{min}^{-1}$ )
  - ▶  $k$  = időegység alatt eltávolított gyógyszer hányad
- ▶  $V$  = térfogat (ml) (vagy  $V_d$  = megoszlási térfogat (ml))

# Kapcsolat a két számítási mód között

- ▶ Bármely folyamat sebessége leírható, mint  $kQ$ , ahol  $k$  egy sebességi állandó, a  $Q$  meg egy pl. gyógyszer mennyiség
- ▶ Elimináció sebessége =  $k_{el} Q$ ,
- ▶ Emlékezzünk  $V_d = Q/c_p$  (múlt szeminárium) →
  - ▶ És ezért  $Q = c_p V_d$
  - ▶ Az elimináció sebessége =  $k_{el} c_p V_d$
- ▶ Az elimináció sebessége a teljes testre (X) =  
 **$X = CL_{Total} c_p$**

A kettőt kombinálva,

$CL_{Total} c_p = k_{el} c_p V_d$  és egyszerűsítve:

$$CL_{Total} = k_{el} V_d$$

Gyógyszerek  
plazmakoncentrációja  
ismételt adagolás után.  
Telítő és fenntartó adag

# Telítő dózis

- ▶ Ha nem akarunk 4-5 féleletidőt várni a steady state koncentráció elérésére, akkor szükséges telítő dózis
- ▶ Ez kiszámítható az előző szemináriumi képlettel:

$$V_D = \frac{Q}{C_P} \quad \rightarrow \quad Q = V_D * C_P$$

$V_D$  = látszólagos eloszlási térfogat

$C_P$  = plazma koncentráció

$Q$  = dózis (telítő dózis)

- ▶ Egy különbséggel:  $C_P$  helyett  $C_{SS}$ -t használunk  
Ez a telítő dózis definíciójából következik:  
steady state koncentráció eléréséhez szükséges a teljes eloszlási térben:

$$Q = V_D * C_{SS}$$

Ha egy gyógyszer biohasznosulása (lásd egy későbbi szemináriumon) kisebb, mint 100%, egy faktort alkalmazunk:  $Q = \frac{V_D * C_{SS}}{F}$

például ha a biohasznosulás 70%  $\rightarrow F=0.7$



# Fenntartó dózis

- ▶ Ha folyamatosan adunk egy gyógyszert, olyan dózisérték (adagolási sebességet, mg/h) kell használnunk, ami a gyógyszer-koncentrációt a terápiás ablakban tartja
- ▶ Ez kiszámolható az ezen szemináriumi képlet alapján:

$$X = C_{ss} \times Cl_{tot}$$

- ▶ Ismét, ha a gyógyszer biohasznosulása kisebb, mint 100%, egy faktort kell alkalmazni:  $X = \frac{C_{ss} \times Cl_{tot}}{F}$

# Gyógyszerek vérszintgörbéi egyszeri adás után

- ▶ Egy kompartmentes modell, *intra vénás* adagolás
- ▶ Egy kompartmentes modell, *per os* adagolás
- ▶ Két kompartmentes modell, *intra vénás* adagolás

# Gyógyszerek vérszintgörbéi folyamatos adagolás esetén

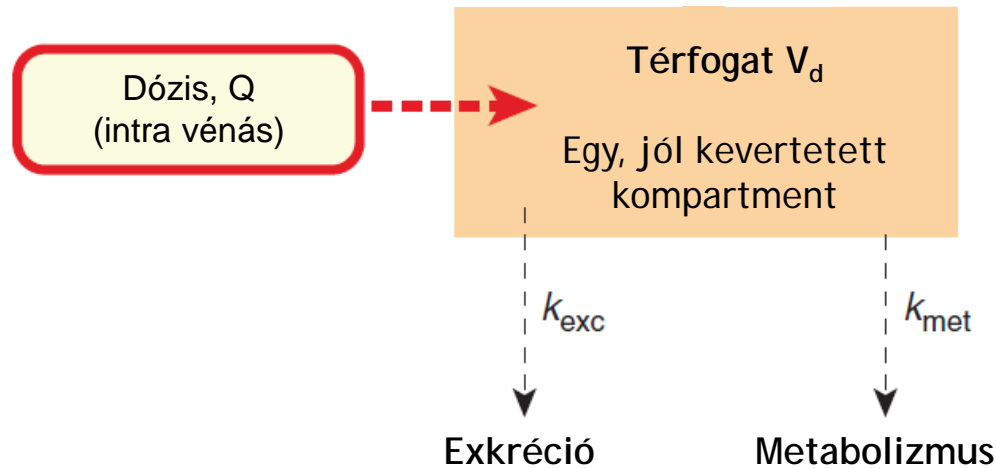
- ▶ Egy kompartmentes modell, *intra vénás* adagolás
- ▶ Egy kompartmentes modell, *per os* adagolás

## Nullad-rendű/Telítési kinetika VS Első-rendű kinetika

- ▶ Egy kompartmentes modell, *intra vénás* adagolás

Első-rendű  
kinetika

# Egy kompartmentes modell, egyszeri *intra vénás* adagolás



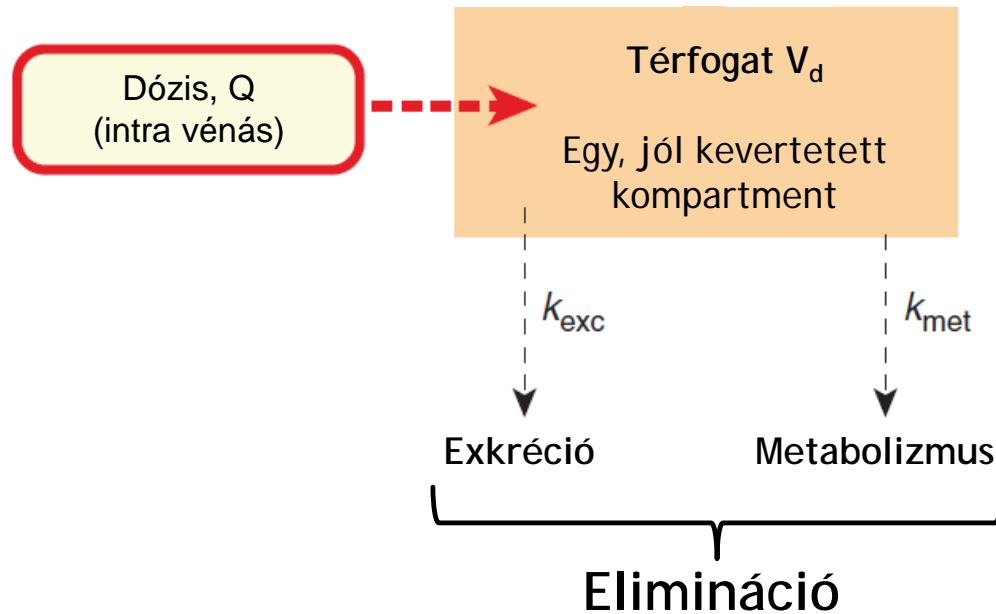
$$Q = \underbrace{C_0 \times V_d}$$

A gyógyszer mennyisége  
a szervezetben  
a beadás pillanatában  
( $t_0$  időpontban)

Képzeljünk el egy végtelenül leegyszerűsített ember-modellt, amely egyetlen jól kevertetett,  $V_d$  eloszlási terű kompartmentből áll, amelybe  $Q$  mennyiségű gyógyszert adunk be gyors intravénás injekció formájában, és amelyből ez csak úgy szabadulhat, hogy metabolizálódik, vagy exkrécióra kerül.

A beadás pillanatában a gyógyszer mennyisége a szervezetben megegyezik a beadott  $Q$  mennyiséggel.

# Egy kompartmentes modell, egyszeri *intra vénás* adagolás



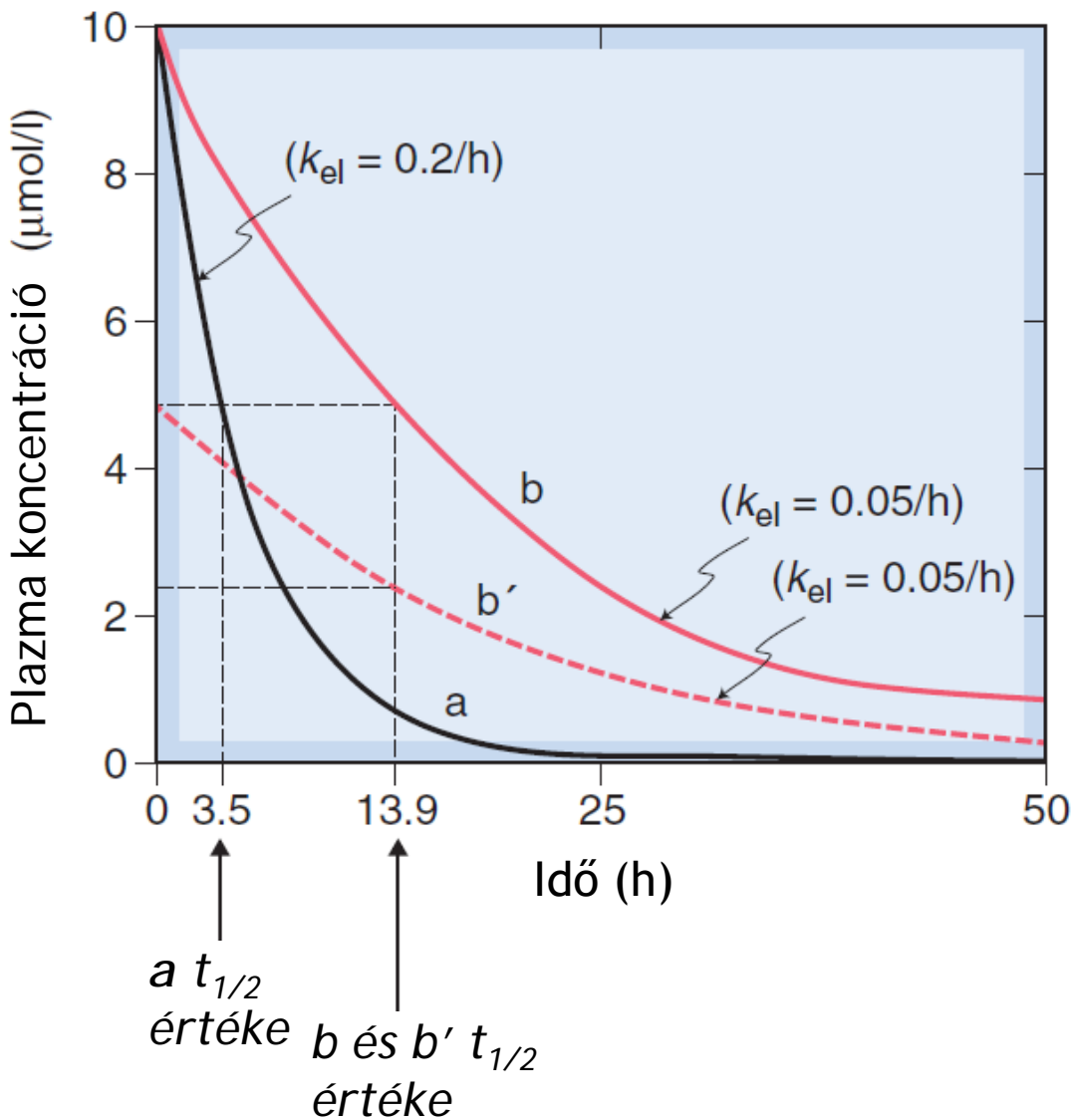
$$CL = \underbrace{k_{el}} \times V_d$$

Az a térfogat ami megtisztul a gyógyszertől egységnyi idő alatt

Képzeljünk el egy végtelenül leegyszerűsített ember-modellt, amely egyetlen jól kevertetett,  $V_d$  eloszlási terű kompartmentből áll, amelybe  $Q$  mennyiségű gyógyszert adunk be gyors intravénás injekció formájában, és amelyből ez csak úgy szabadulhat, hogy metabolizálódik, vagy exkrécióra kerül.

Az exkréciót és a metabolizációt közösen eliminációnak nevezzük, melyet az eliminációs konstanssal ( $k_{el}$ ) jellemezhetünk

# Egy kompartmentes modell, egyszeri *intra vénás* adagolás



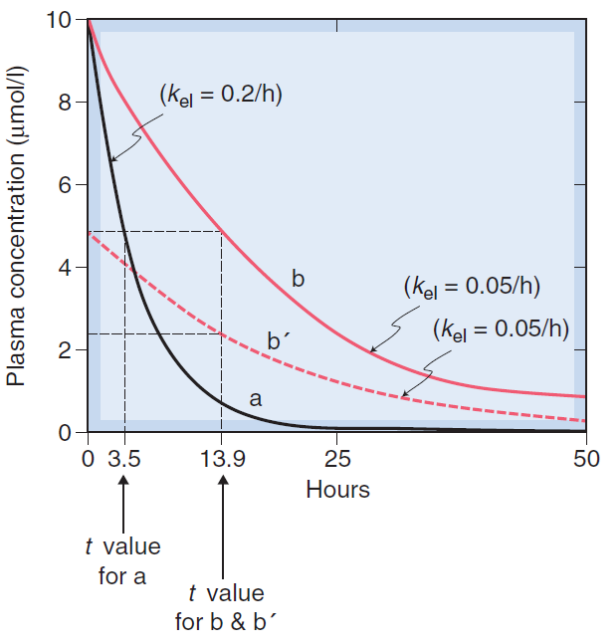
A koncentráció exponenciálisan csökkenve tart a nullához: egy fél-életidő múlva a konc. a kezdeti felére esik; két fél-életidő múlva a kezdeti negyedére csökken; három múlva nyolcadára; és így tovább.

➔ minél hosszabb a fél-életidő, annál hosszabb ideig marad a gyógyszer a szervezetben az adagolás végeztével.

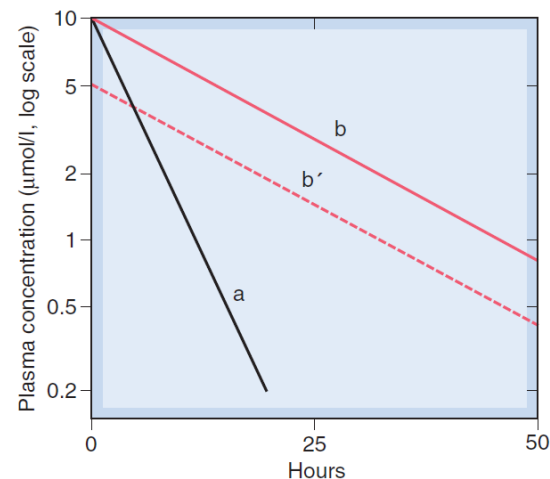
Az **a** és **b** gyógyszer csak eliminációs konstansukban ( $k_{el}$ ) különböznek,

A **b'** görbe a **b** gyógyszer kisebb adagjának koncentráció-idő görbéje. Vegyük észre, hogy a fél-életidő ( $t_{1/2}$ ) nem függ a dózistól.

# Egy kompartmentes modell, egyszeri *intra vénás* adagolás



=



A plazma koncentráció  
logaritmikus skálán  
ábrázolva

# Egy kompartmentes modell, egyszeri *intra vénás* adagolás

Itt az egyenes vonal jelenti azt, hogy a koncentráció exponenciálisan csökken.

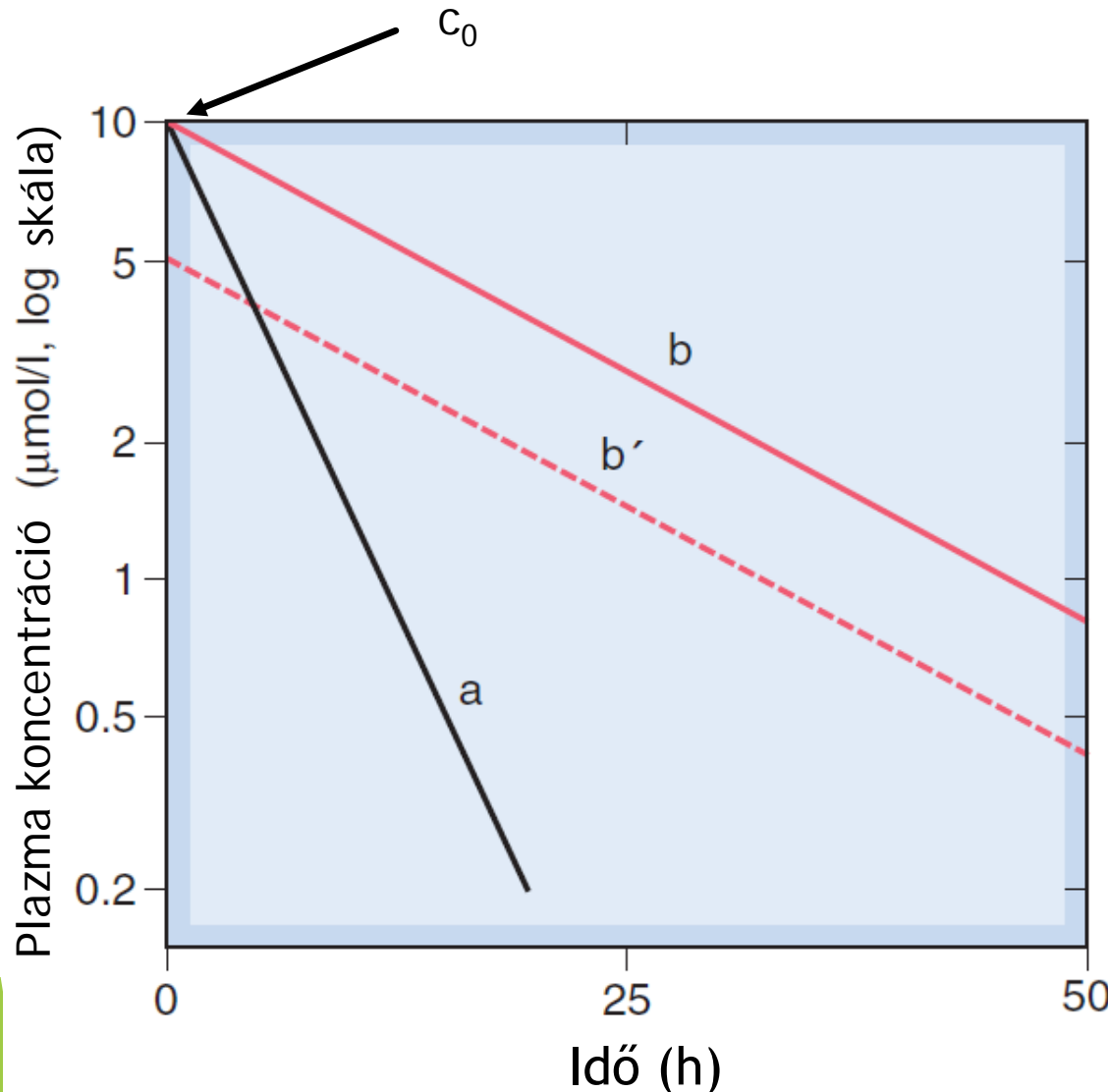
Ez hasznos, mert:

Extrapolációval az Y-tengely metszéspontja a nulla időpontban megadja a  $C_0$ -t, a kiindulási koncentrációt, és így a  $V_d$ -t, a megoszlási térfogatot.

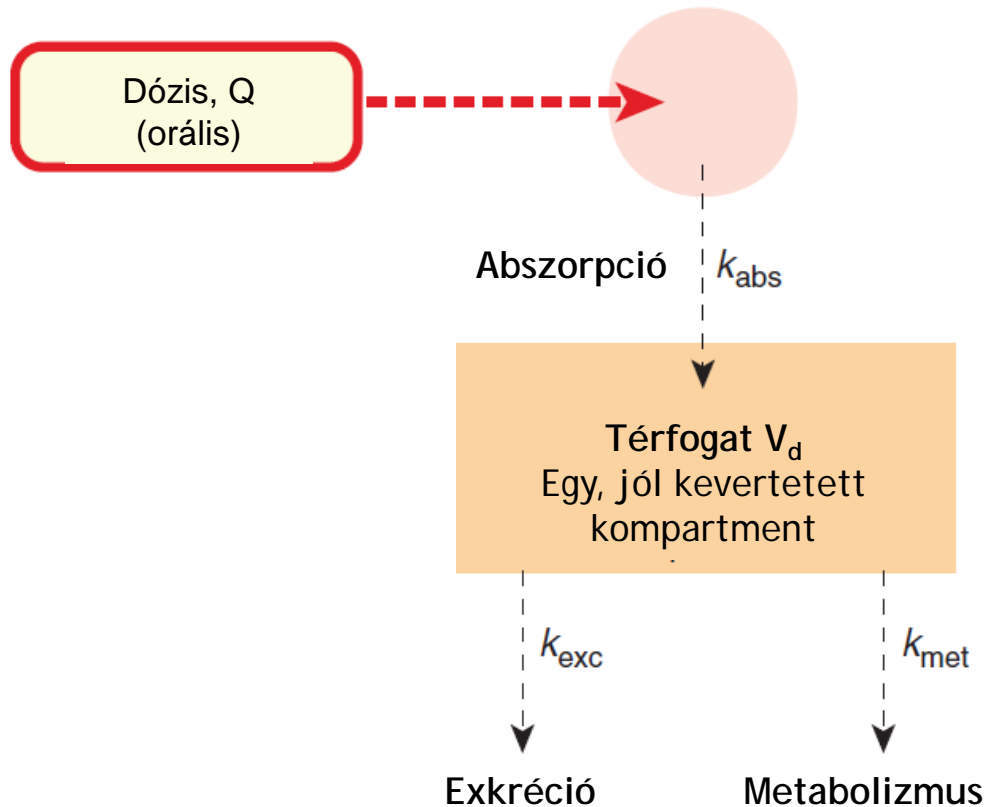
$$Q = C_0 \times V_d$$

Az egyenes vonal meredeksége az  $k_{el}$ -től függ, így kiszámolható a CL.

$$CL = k_{el} \times V_d$$



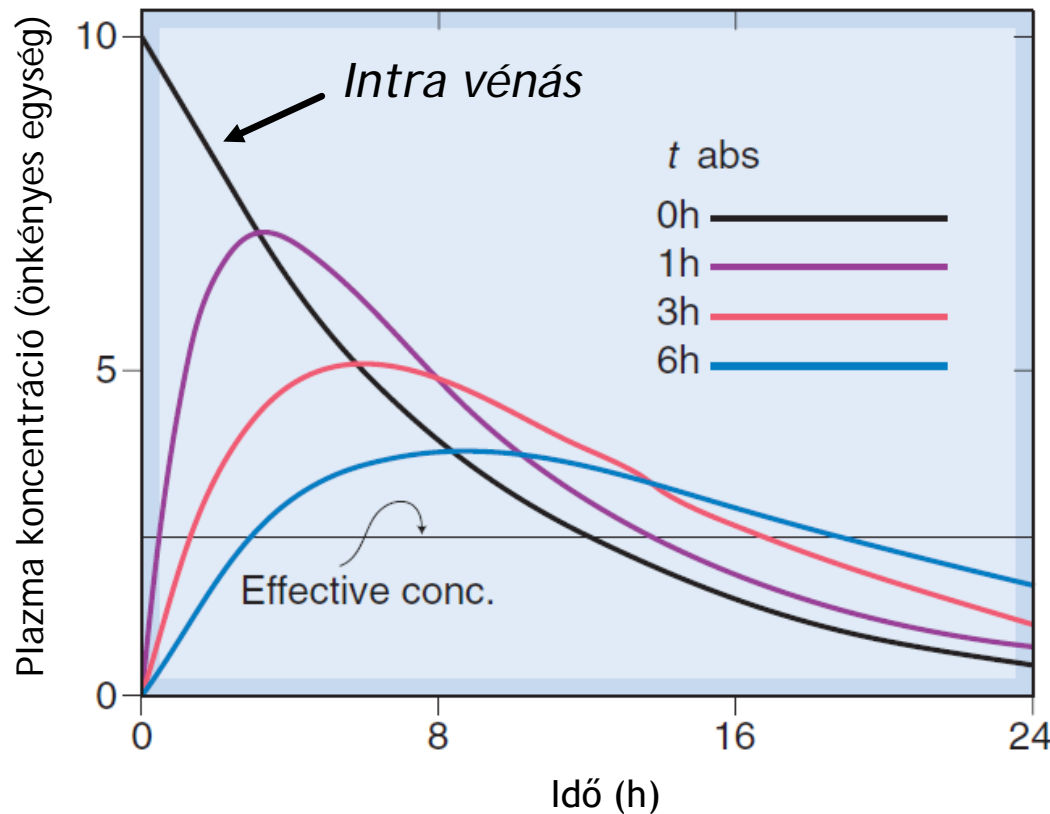
# Egy kompartmentes modell, egyszeri *per os* adagolás



Ebben az esetben  
abszorpció módosítja a  
görbe alakját



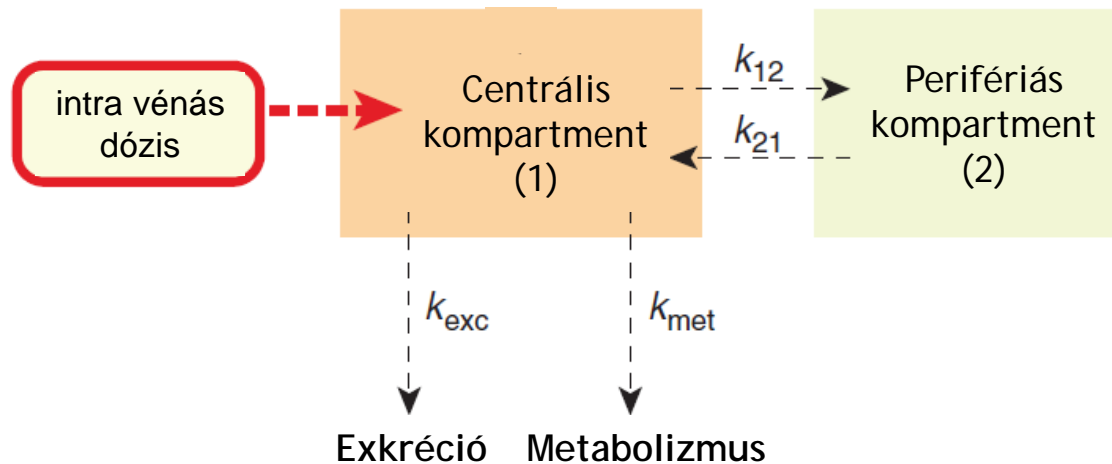
# Egy kompartmentes modell, egyszeri per os adagolás



Az eliminációs fél-életidő 6 h.  
Az abszorpció fél-életidők ( $t_{1/2 \text{ abs}}$ ) az ábrán jelölve.  
(Nulla jelöli az azonnali abszorpciót, vagyis az intra vénás adagolást.)

Megfigyelhető, hogy a csúcs plazma koncentráció alacsonyabb és késik lassú abszorpció esetén, és a hatás időtartama valamelyest hosszabb.

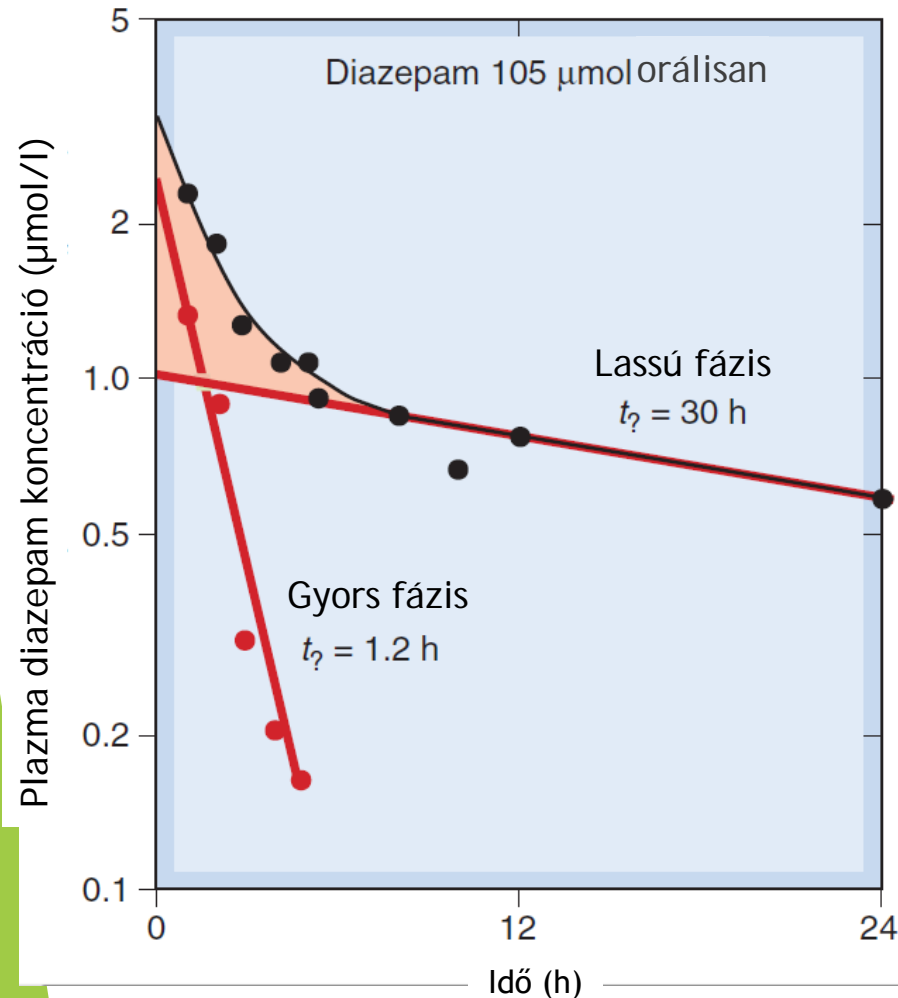
# Két kompartmentes modell, egyszeri *intra vénás* adagolás



A két kompartmentes modell egy gyakran használt megközelítés amelyben a szöveteket egy perifériás kompartmentként kezeljük.

A gyógyszer molekulák a perifériás kompartmentet csak a centrális kompartmenten keresztül érik el, ami a vérplazmát szimbolizálja.

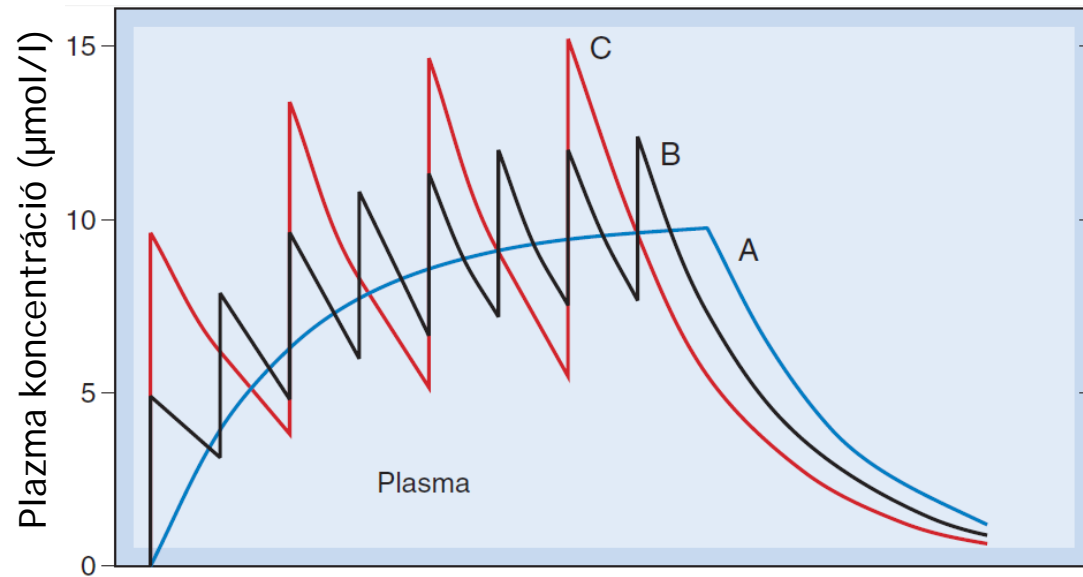
# Két kompartmentes modell, egyszeri *intra vénás* adagolás



A második kompartment hozzáadása a modellhez, egy második exponenciális komponenst jelent a koncentráció-hatás görbén, így a görbének lesz egy gyors és egy lassú szakasza.

A grafikonon a koncentráció szemilogaritmikusan van ábrázolva. A kísérletes adatok (fekete pontok) egy olyan görbe mentén helyezkednek el, ami kb 8h múlva (lassú fázis) kiegyenesedik. A korai pontok ettől az egyenestől való eltérését (rózsaszín terület) ábrázolva (piros pontok) megkapjuk a gyors fázis egyenest.

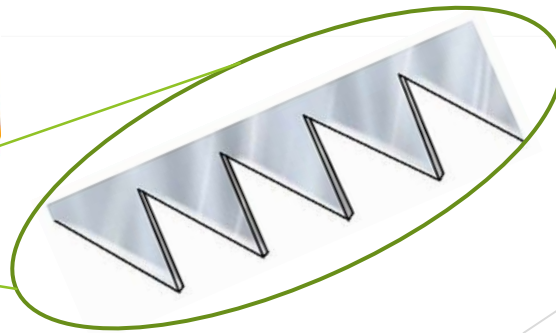
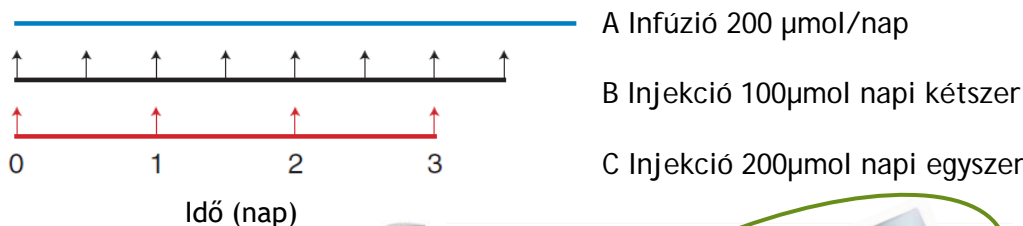
# Egy kompartmentes modell, folyamatos *intra vénás* adagolás



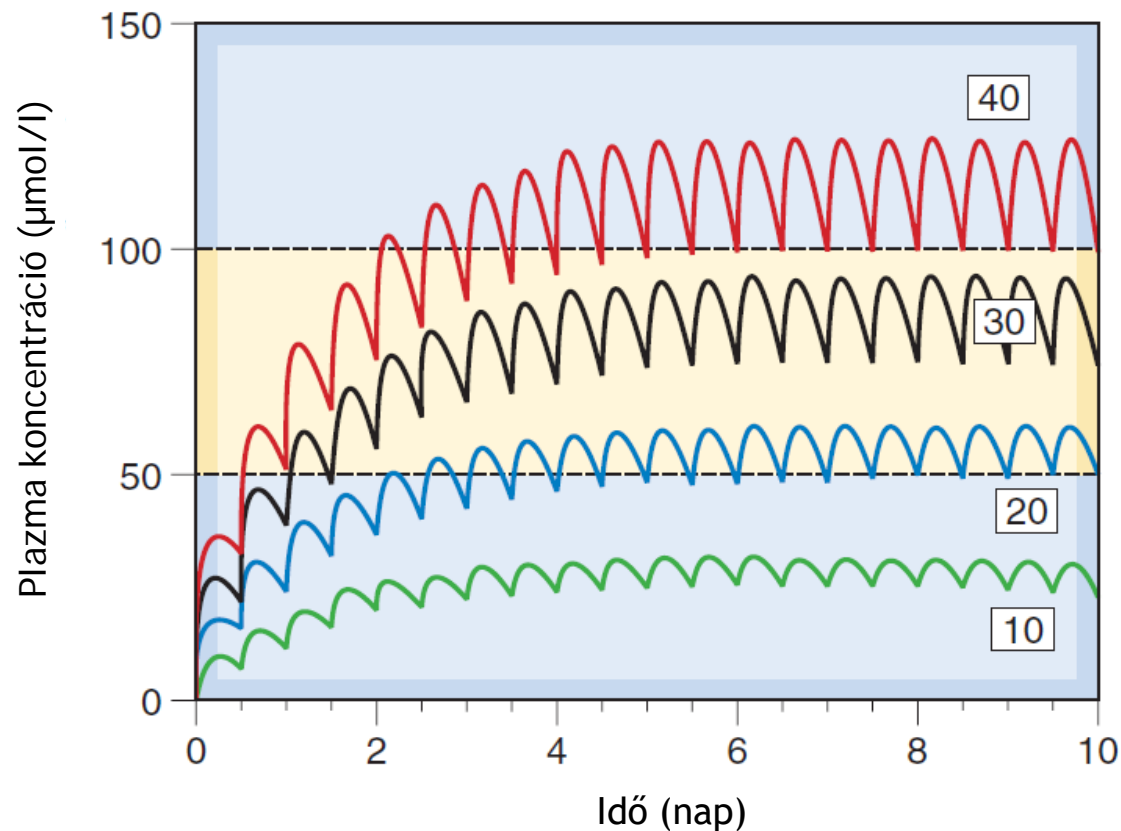
A sima **A** görbe 4 nap **folyamatos infúzió** hatását mutatja; a **B** görbénél ugyanaz a teljes gyógyszer mennyiség, csak **nyolc egyenlő adagban** adva; és a **C** görbénél ugyanaz az össz mennyiség, **négy egyenlő adagban** adva

A gyógyszer félélet-ideje 17h, a látszólagos megoszlási térfogat 20L.

Megfigyelhető, hogy minden esetben a steady-state kb 3 nap (négy féléletidő) után érhető el, és a steady-state átlag-koncentrációja ugyanaz.



# Egy kompartmentes modell, folyamatos *per os* adagolás



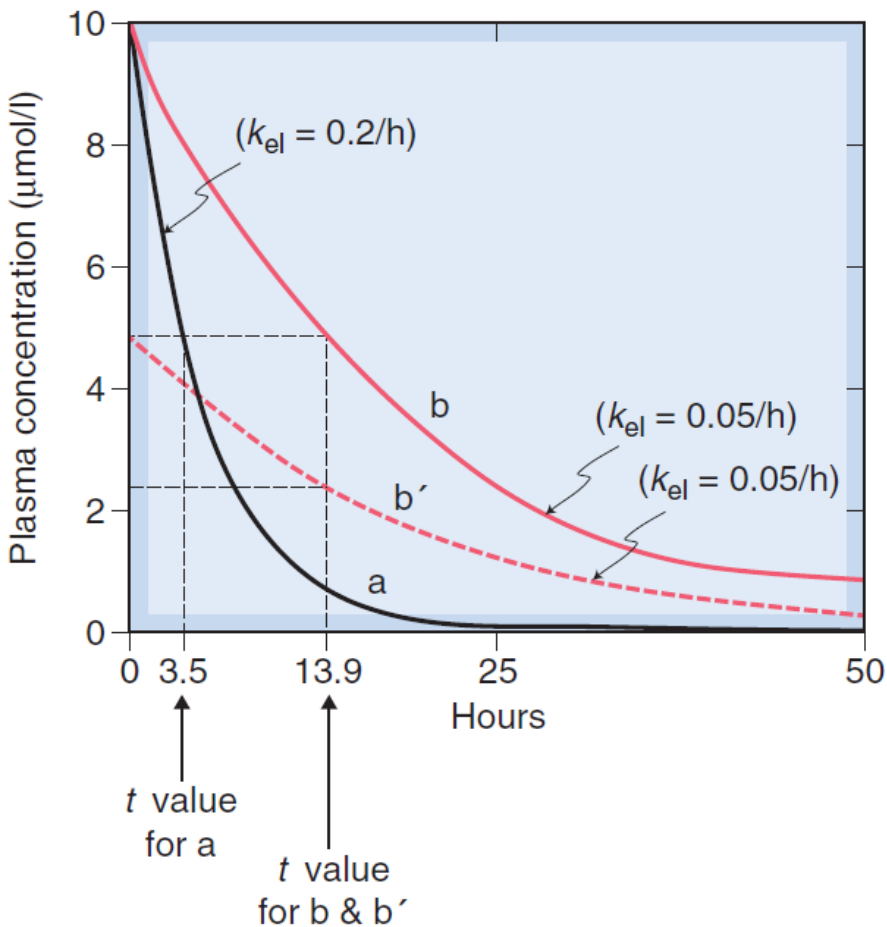
Az abszorpció módosítja a képet.  
Magasabb koncentrációk esetén, a steady state koncentráció szintén magasabb

# Nulladrendű/telítési kinetika

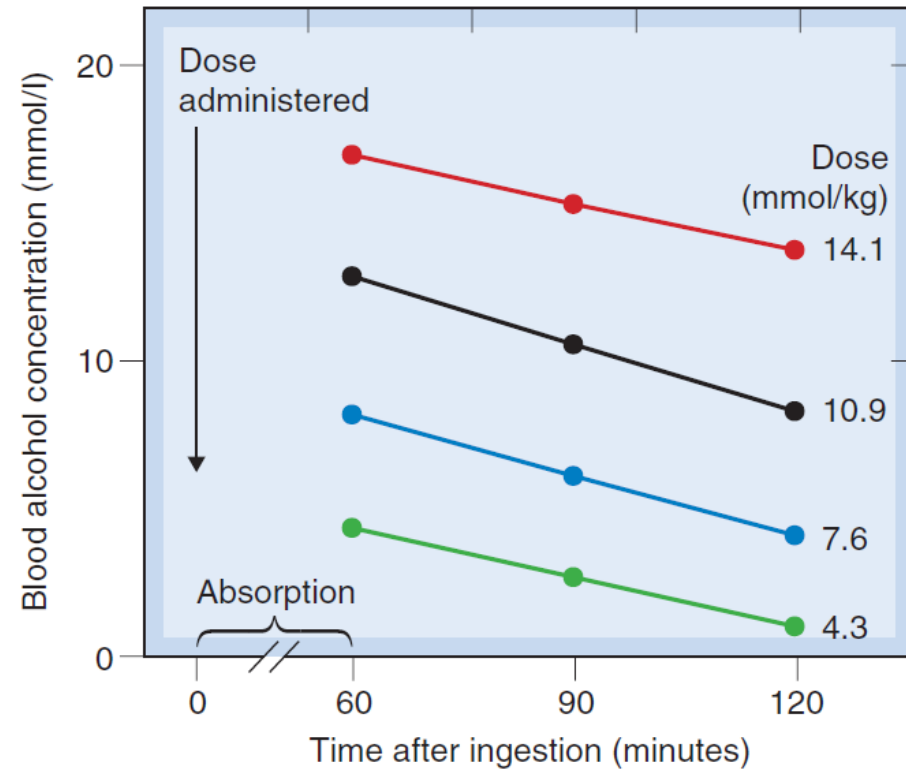
VS

## Első-rendű kinetika (eddig ismertettek)

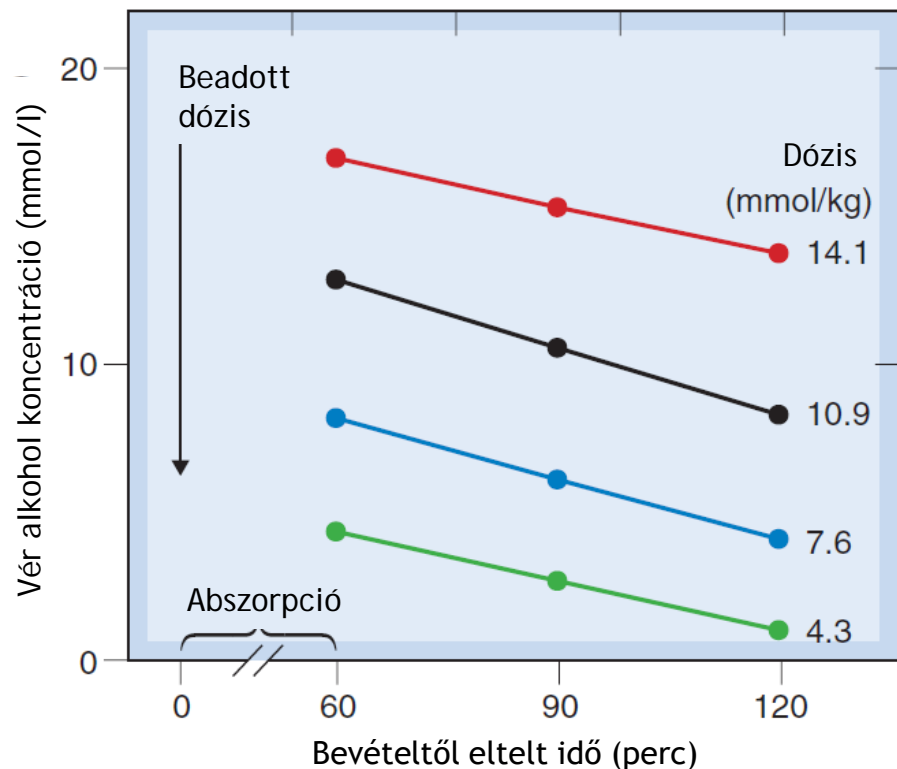
Első-rendű kinetika



Nullad-rendű kinetika  
(Ez NEM szemi-logaritmikus)



# Nulladrendű/telítési kinetika

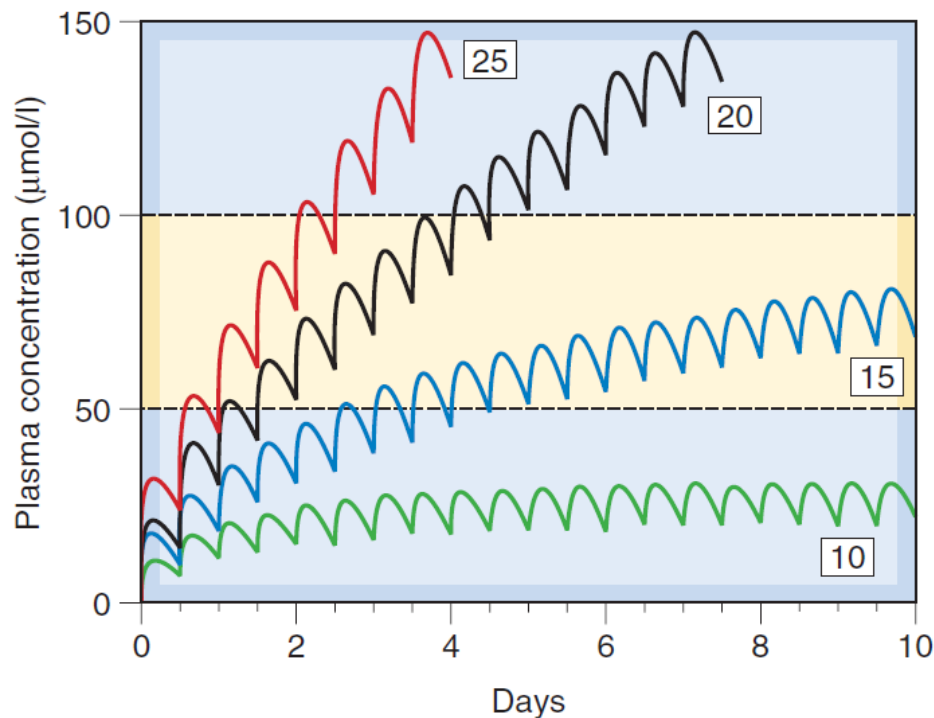


A vér-alkohol koncentráció lineárisan csökken nem exponenciálisan, és a csökkenés mértéke nem függ a dózistól. A szer plazma-koncentrációtól függetlenül állandó sebességgel eliminálódik

A nulladrendű kinetika telített metabolizmusra jellemző  
➔ az elimináció kapacitása korlátozott

Példák: **etanol**, **fenitoin** és **szalicilát**

# Zero-order/saturation kinetics



A korlátozott eliminációs kapacitás miatt:

Megfigyelhető, hogy a fenitoin nagy dózisaival nem érhető el steady state, és kis dózis-emelés egy idő után aránytalanul nagy plazmakoncentráció-növekedést okoz.

A metabolizmus maximális sebessége határt szab az adható gyógyszer mennyiségnek; Ha ezt meghaladjuk, a gyógyszer mennyisége a szervezetben a végtelenségig nő és soha nem ér el steady state-et.

Példák: **etanol**, **fenitoin** és **szalicilát**



Szemcsepppek

# Szemcseppek

- ▶ Def.: A szemcseppek egy vagy több hatóanyagot tartalmazó, steril, vizes vagy olajos oldatok, illetve szuszpenziók, melyeket szembe csepegtetve alkalmazunk. (Ph.Hg.VIII.)
- ▶ Def. (2): A *szemcsepp (oculogutta)* a szem szaruhártyájának vagy a szemhéj alatti kötő- hártyának a gyógyszeres kezelésére szánt steril vagy megfelelő mikrobiológiai tisztaságú vizes vagy olajos oldat. (Ph.Hg.VII.)
- ▶ A szem kezelésére szánt rendszer lehet emulzió vagy szuszpenzió is. Az egyadagos szemcseppek egyszeri becseppentésre szolgálnak, a többadagos szemcseppek többszöri felhasználásra szánt készítmények.
- ▶ A szemcseppek az összetett oldatok csoportjába tartoznak, mert a hatóanyagon kívül rendszerint tartalmaznak segédanyagot is.

# A szemcseppek készítésének segédanyagai:

- ▶ Mikrobiológiai tartósítószer (köv. dia)
- ▶ Viskozitást növelő szerek (hidroxi-etil-cellulóz, polivinil-alkohol)
- ▶ Izotonizáló szerek (nátrium-klorid, kálium-nitrát, mannit)
- ▶ pH beállítására alkalmazott szerek (izohidriát beállító pufferrendszerek (borát, foszfát, acetát))
- ▶ Antioxidánsok (nátrium-diszulfid, aszkorbinsav)

# Mikrobiológiai tartósítószer

- ▶ A szemcseppeket *aszéptikus körülmények*\* között és mikrobiológiai szempontból *tartósítva*, *aszéptikusan*, *vagy sterilezve* kell készíteni.
- ▶ A többszöri kezelésre szánt, hővel nem sterilezhető, de tartósítószer tartalmazó oldatokat letöltés előtt **baktériumszűréssel** (membránszűrő) kell mikrobamentesíteni, majd az aszeptikus gyógyszerkészítés elvei szerint letölteni és lezárni.
- ▶ Nincs szükség külön tartósítószerre, ha a hatóanyag az alkalmazott töménységben a mikrobiológiai tartósítást biztosítja. (pl. Oculogutta neomycini, Oculogutta chloramphenicoli)

\*Eszközök, technológiai berendezések: hőlégmenterizáló, aszeptikus fülke, lamináris fülke, membránszűrő, germicid lámpa, steril munkaruha, 70%-os alkohol (munkaterület dezinficiálására), személyi higiénia stb.

# Mikrobiológiai tartósítószer

## *Általánosan alkalmazott tartósítószer:*

- ▶ Fenil-higany-borát 0.002 %-ban
- ▶ Tiomerzál 0.002 %-ban
- ▶ Benzalkónium-klorid 0.005-0.01%-ban
- ▶ Cetrimid 0,01%-ban

## *A FoNo VII.-ben hivatalos tartósító oldatok:*

- ▶ Benzalkonium chloratum solutum 10 %
- ▶ Thiomersalum solutum 0.1 %

# Szemcseppek eltartása, expediálása

- ▶ A szemcseppeket cseppentő feltétellel ellátott steril üvegben, vagy e célra szolgáló garanciazáras műanyag tartályban, cseppentő feltétellel expediáljuk.
- ▶ A szemcseppeket fénytől védve, hideg helyen kell tartani. („hideg helyen tartandó”: 2-8 °C között, hűtőszekrényben, fagyasztás nélkül kell tárolni)
- ▶ A szignatúrán jelezni kell a készítmény *felbontástól számított eltarthatóságát*. Leggyakrabban 1 hét a felhasználhatósági idő.

# A szemcseppek készítéséhez használt oldószerek:

- ▶ Aqua destillata pro injectione (vizes oldatok, szuszpenziók) Ph.Hg.VII.,
- ▶ Oleum ricini sterilizatum (lipofil oldószer) Ph.Hg.VII.,
- ▶ Solvens pro oculoguttis cum benzalkonio (FoNo VII.)
- ▶ Solvens pro oculoguttis cum thiomersalo (FoNo VII.)
- ▶ Solvens viscosa pro oculoguttis (FoNo VII.)
- ▶ Solutio ophtalmica cum benzalkonio (FoNo VII.)

Melyiket használjuk?



# A szemcseppek készítéséhez használt oldószerek:

- ▶ Ha más utasítás nincs → benzalkóniumkloriddal tartósított *szemcseppekhez való oldószerez* - inkompatibilitás esetén tiomerzállal tartósított oldószerez - készítjük. (*Solvens pro oculoguttis cum benzalkonio* / *Solvens pro oculoguttis cum thiomersalo*)  
Ez az oldat közel *izotóniás*.
- ▶ *Alkaloid sók* esetén (atropin-szulfát, homatropin-bromid, naphazolin-klorid, pilokarpin-klorid, szkopolamin-bromid, tetrakain-klorid) → benzalkónium kloriddal tartósított *szemészeti alapoldat* javasolt (*Solutio ophtalmica cum benzalkonio*).  
A szemészeti alapoldat közel *izotóniás és izohidriás*.
- ▶ Az *alkaloid bázisokat* (pl. pilokarpin) → steril ricinusolajban oldjuk (*Oleum ricini sterilizatum*).
- ▶ Viszkózus szemcseppek készítéséhez → viszkózus oldószert használunk, (*Solvens viscosa pro oculoguttis*) amely 0,8% hidroxietil-cellulózt, 0,7% nátrium-kloridot tartalmaz. Az oldat cetrimiddel vagy tiomerzállal van tartósítva.
- ▶ Antibiotikum tartalmú szemcseppek esetén → injekcióhoz való desztillált víz (*Aqua ad injectabilia*) használatos.



Kötelelzően  
tudandó receptek a  
témából

# Pilocarpin tartalmú szemcsepp glaucoma kezelésére

Rp./

- Pilocarpinum hydrochloridum 0.1g
- Solutio ophtalmica cum  
benzalkonio FonoVII ad 10g

Pilocarpini hydrochloridi  
centigrammata decem (g 0,10)

Solutionis ophtalmicae cum benzalkonio FoNo VII  
ad grammata decem (ad g 10,0)

Misce fiat oculogutta

Detur ad vitrum fuscum guttatorium

Da sub signo veneni!

Signetur: Külsőleg. 1%-os pilokarpin szemcsepp.

# *Atropin tartalmú szemcsepp*

Rp./

Atropini sulfatis

centigrammata decem (g 0,10)

Solutionis ophthalmicae cum benzalkonio FoNo VII

ad grammata decem (ad g 10,0)

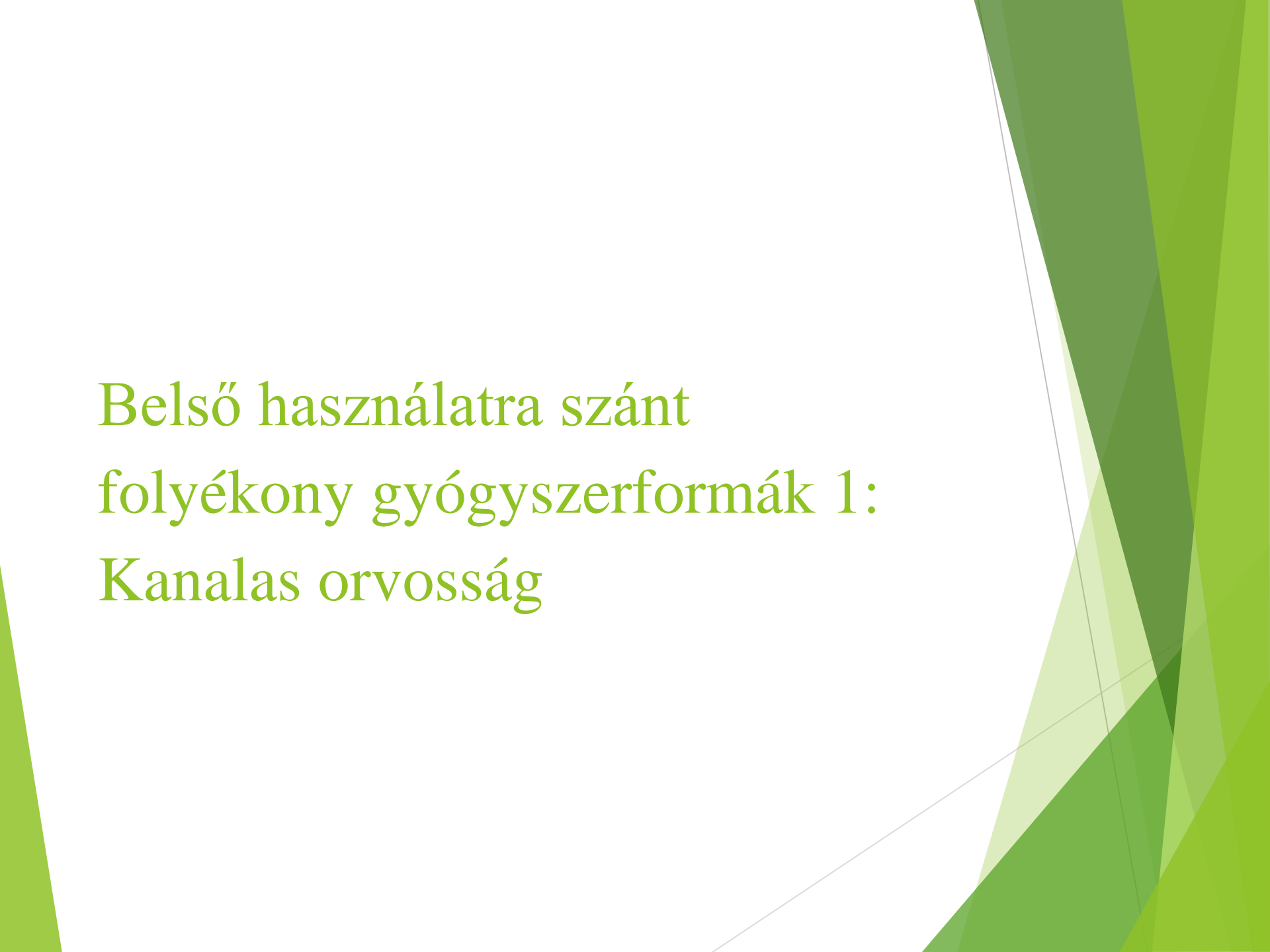
Misce fiat oculogutta.

Detur ad vitrum fuscum guttatorium.

Da sub signo veneni!

Signetur: Külsőleg. 1%-os atropin szemcsepp

- Atropinum sulfas 0.1g
- Solutio ophtalmica cum benzalkonio FonoVII ad 10g

The background of the slide features abstract, overlapping green geometric shapes, primarily triangles and polygons, in various shades of green, creating a modern and dynamic visual effect.

# Belső használatra szánt folyékony gyógyszerformák 1: Kanalas orvosság

# Belső használatra szánt folyékony gyógyszerformák 1: Kanalas orvosság

- ▶ Mik tartoznak ide?
  - ▶ Oldatok
  - ▶ Emulziók
  - ▶ Szuszpenziók
  - ▶ Gyógyszeres kivonatok (extraktumok, tinktúrák, főzetek, forrázatok, mixturák, elixírek) **(lásd következő szemináriumon)**
- ▶ Ph.Hg.VIII.: A bevételre szánt/orális, folyékony gyógyszerkészítmények rendszerint olyan oldatok, emulziók vagy szuszpenziók, amelyek megfelelő vivőanyagban egy vagy több hatóanyagot tartalmaznak. Egyes készítmények kizárólag folyékony hatóanyag(ok)ból állnak(orális folyadékok).

# Oldatok

- ▶ FoNo VII.: Az oldat (solutio) hatóanyag(ok) oldásával készült, bevételre vagy külsőleges használatra szánt üledékmentes, tiszta, folyékony gyógyszerkészítmény. Anyagszerkezeti szempontból a valódi oldatokkal azonos rendszernek tekinthetők a per os bevételre szánt cseppek, oldatos szemcseppek, orrcseppek, fülcseppek, a szirupok és elixírek is.
- ▶ Ph.Hg.VII.: Az oldat- mint gyógyszerforma- gyógyszeranyagoknak megfelelő oldószerrel való oldásával készült, bevételre vagy külső használatra szánt, üledékmentes, tiszta, folyékony gyógyszerkészítmény.

# Oldatkészítés során használható segédanyagok :

- ▶ 1. Az oldékonyság növelésére (példák):
  - ▶ - a rossz oldékonyságú hatóanyag helyett a vegyület jó vízdékonyságú sójának használata: pl.: Phenobarbitalum helyett Phenobarbitalum natrium
  - ▶ - kémhatás változtatása: pl.: 2M HCl vagy 2M NaOH
  - ▶ - szolubilizálószer: pl.: tenzidek (Polysorbátum 20)
- ▶ 2. Mikrobiológiai tartósítószer:
  - ▶ - Solutio conservans
  - ▶ - Acidum sorbinicum
- ▶ 3. Íz- és szagjavítók:
  - ▶ - Szirupok: pl.: Sirupus simplex (Ph.Hg.VII.) Sirupus aurantii (Ph.Hg.VII.) Sirupus rubi idaei (FoNo VII.) Sirupus sorbiti (FoNo VII.)
  - ▶ - Alapoldatok (koncentrált aromás vizek)(FoNo VII.): pl.: Diluendum benzaldehydi, Diluendum menthae
  - ▶ - Engedélyezett ízjavító

# Emulziók

- ▶ Definíció (Ph. Hg. VII. ill. FoNo VII.):
- ▶ Az emulzió-mint gyógyszerforma, bevétele vagy külső használatra szánt, egymással nem elegyedő fázisokból álló folyékony gyógyszerkészítmény, amelyben az egyik fázis a másikban tartósan diszpergált.
- ▶ A külső használatra szánt emulziókat szokták linimentumnak is nevezni (de nem minden linimentum emulziós rendszer).
- ▶ „Használat előtt felrázandó” kiegészítő szignatúrával látjuk el.
- ▶ Típusai:
- ▶ O/V: a diszperz fázis (belső fázis) olaj vagy lipofil folyadék, a diszperziós közeg (külső fázis) víz vagy hidrofil folyadék a bevétele szánt emulzió csak O/V típusú lehet
- ▶ V/O: a diszperz fázis (belső fázis) víz vagy hidrofil folyadék, a diszperziós közeg (külső fázis) olaj vagy lipofil folyadék
- ▶ Összetett emulziók: lehetnek V/O/V vagy O/V/O típusúak, 2 határfelületük van, nyújtott hatású készítmények
- ▶ Példák:  
Emulsio olei jecoris (roborans),  
Emulsio olei ricini (purgativum),  
Emulsio paraffini cum phenolphthaleino (laxativum)



# Emulziók alkalmazásának előnyei:

- ▶ 1. per os
  - ▶ - lipidoldékony hatóanyagok (vitaminok, olajok) bevitelét megkönnyíti
  - ▶ - kellemetlen ízű vegyületek ízfedése
  - ▶ - egyes hatóanyagok felszívódását elősegítik
- ▶ 2. **külsőleg**
  - ▶ - jobb penetrációs képesség
  - ▶ - jobb hidratáló és hűsítő hatás, mint a tisztán lipofil vagy hidrofil készítményeknek
- ▶ 3. iv.
  - ▶ - lipidoldékony anyag bejuttatása
  - ▶ - parenterális táplálás mikrodiszperz zsíremulziókkal
- ▶ 4. im.
  - ▶ - vízdoldékony hatóanyag elhúzódo hatásának biztosítása

# Az emulziókészítés segédanyagai:

## ► 1. *Emulgensek*

- Minden emulzió készítésekor használjuk, mert csak ezek alkalmazásával lehet stabil emulziót előállítani.
- Csökkentik a 2 folyadék közös határfelületén kialakult határfelületi feszültséget, megkönnyítve ezzel az emulgeálási munkát. A felületaktív anyagok irányítottan adszorbeálódnak a határfelületen, a hidrofób részük az olajos fázisban, a hidrophil részük pedig a vízes fázisban helyezkedik el. Ezáltal a cseppek felületén egy monomolekuláris filmréteg alakul ki, amely megakadályozza a cseppek összefolyását, így tovább nő az emulzió stabilitása.
- *orális felhasználásra* leggyakrabban: poliszorbát 20 (Polysorbatum 20)

## ► 2. *Viszkozitást növelő stabilizátorok*

- A külső fázis viszkozitásának növelésével megakadályozzák, illetve késleltetik a diszpergált részecskék tömörülését, összefolyását. Ilyen segédanyagok a nyákok és gélek, melyek nagy koncentrációban biztosítják az emulziók stabilitását. Ha az emulziót hígítják, akkor a stabilitásuk jelentősen romlik és megindul a belső fázis elkülönülése.
- Pl.: a hidroxil-etil-cellulóz nyák (Mucilago hydroxyethyl cellulosum)

## ► 3. *Mikrobiológiai tartósítószer*

- O/V típusúakhoz mindig használni kell.  
(a bevételre szánt emulzió csak O/V típusú lehet)
- Pl.: Solutio conservans

## ► 4. *Íz-és szagjavító anyagok*

- Pl.: vanillin (Vanillinum), szacharin (Saccharinum natricum), szirupok (pl.: Sirupus simplex (szacharóz), Sirupus sorbiti), citromsav (Acidum citricum monohydricum)

# Szuszpenziók

- ▶ DEFINÍCIÓ( Ph. Hg. VII)
- ▶ A szuszpenzió, mint gyógyszerforma, bevételre vagy külső használatra szánt folyékony gyógyszerkészítmény, amelyben a szilárd diszperz fázis a folyékony diszperziós közegben egyenletes eloszlásban lebeg, ill. leülepedés után rediszpergálható.
- ▶ Használat előtt felrázandó kiegészítő szignatúrával látjuk el.
- ▶ Példák:  
Suspensio anaesthetica (érzéstelenítő torokra),  
Susp. Terpini (expectorans),  
Susp. Zinci aquosa (dermatologicum; külsőleges,de gyakori)

# Az szuszpenziókészítés segédanyagai:

## ▶ 1. *Nedvesítőszerek*

- ▶ Csökkentik a határfelületen kialakult határfelületi feszültséget, megkönnyítve ezzel az szuszpendálási munkát. A felületaktív anyagok irányítottan adszorbeálódnak a határfelületen. Ezáltal a szilárd részecskék felületén egy monomolekuláris filmréteg alakul ki, amely elősegíti a részecskék nedvesedését, így növeli a szuszpenzió stabilitását.
- ▶ *orális felhasználásra* leggyakrabban: poliszorbát 20 (Polysorbatum 20)

## ▶ 2. *Viszkozitást növelő stabilizátorok*

- ▶ A diszperziós közeg viszkozitásának növelésével megakadályozzák, illetve késleltetik a diszpergált részecskék tömörülését, ülepedését. Ilyen segédanyagok a nyákok és gélek, melyek nagy koncentrációban biztosítják az szuszpenziók stabilitását. Ha a szuszpenziót hígítják, akkor a stabilitásuk jelentősen romlik és megindul a belső fázis elkülönülése.
- ▶ Pl.: a hidroxetil-cellulóz nyák (Mucilago hydroxyethyl cellulosum)

## ▶ 3. *Mikrobiológiai tartósítószer*

- ▶ Pl.: Solutio conservans

## ▶ 4. *Íz-és szagjavító anyagok*

- ▶ Pl.: vanillin (Vanillinum), szacharin (Saccharinum natricum), szirupok (pl.: Sirupus simplex (szacharóz), Sirupus sorbiti), citromsav (Acidum citricum monohydricum)

# Kötelelzően tudandó receptek a témából

# *Metamizol (=noraminophenazon) tartalmú kanalas orvosság gyermeknek korrigenssel*

- ▶ Metamizolum natricum 2g
- ▶ Sirupus simplex 40g
- ▶ Aqua purificata ad 100g

Rp./

Metamizoli natrici  
grammata duo (g 2,0)

Sirupi simplicis  
grammata quadraginta (g 40,0)

Aquae purificatae  
ad grammata centum (ad g 100,0)

Misce fiat solutio.

Da ad vitrum.

Signetur: Szükség esetén 2 óránként  
5 ml-t beadni.

# Olajos rázókeverék FoNo szerint

- ▶ Suspendio zinci oleosa
- ▶ Fono dosis (= 100g)

Rp./

Suspensionis zinci oleosae

FoNo dosim unam (I)

Detur ad vitrum fuscum

Signetur: Külsőleg. Olajos rázókeverék.

## SUSPENSIO ZINCI OLEOSA

(Susp. zinc. oleos.)

<b>Zincum oxydatum</b> . . . . .	<b>40,0</b>	<b>g</b>
<b>Oleum helianthi</b> . . . . .	<b>60,0</b>	<b>g</b>

**Expedíció:** Sötét üvegben vagy műanyag tartályban.

**Szignatúra:** Külsőleg. Használat előtt felrázandó. Hűvös helyen tartandó.

**Dermatologicum. Adstringens.**

**"Hatóanyagok:**

**Zincum oxydatum:** *Enyhe adstringens, visszaveri az UV-sugarakat. Helyileg ekzema, kisebb horzsolások, sebek és aranyér kezelésére, valamint fényvédő krémek komponenseként.*

**Javallat:** Heveny, nem nedvedző bőrgyulladás ellen, urticaria, pruritus senilis esetén hűsítésre, a viszketés csillapítására."