

ISSN 0023—1150

АКАДЕМИЯ НАУК  
РЕСПУБЛИКИ УЗБЕКИСТАН

# ХИМИЯ Природных Соединений

СПЕЦИАЛЬНЫЙ ВЫПУСК

1998

– 0.8 мг% и К – 5 мг%. Сумма каротиноидов достигает 200 мг%, из них 23% – каротин. Р-активные полифенолы (75–200 мг%) влияют на проницаемость и эластичность стенок кровеносных сосудов, оказывают лечебно-профилактическое действие на атеросклероз. Витамин F (полиненасыщенные жирные кислоты – линолевая и линоленовая) оказывает разностороннее действие. Фармакологические свойства: болеутоляющее, противовоспалительное, антибактериальное, противоопухолевое.

**Ромашка аптечная.** Хамазулен дает выраженный противовоспалительный эффект, усиливает регенеративные процессы, ослабляет аллергические реакции. Апигенин, апинин и герниарин обладают спазмолитическим действием. Эфирное масло дезинфицирует желудочно-кишечный тракт, уменьшает газообразование, снижает боли и ослабляет воспалительные явления, расширяет сосуды головного мозга, усиливает дыхание. Комплекс других биологически активных веществ обладает успокаивающим, желчегонным, мочегонным, ранозаживляющим, бактерицидным, болеутоляющим, противолучевым действиями.

**Каперсы колючие.** Содержат витамин С (150 мг%), рутин (0.32%), кверцетин, сахара (до 12%), эфирные и жирные масла, каротиноиды, токоферол, флавоноиды. Благодаря содержанию вышеперечисленных биологически активных веществ каперсы колючие положительно влияют на жизненные процессы организма, способствуют повышению тонуса, в том числе половой функции, ускоряют процессы свертывания крови, стимулируют деятельность иммунной системы, помогают излечиванию от бесплодия.

УДК 615.015.4

## ВЫСВОБОЖДЕНИЕ НИКОТИНОВОЙ КИСЛОТЫ ИЗ ТРАНСДЕРМАЛЬНОЙ ЛЕКАРСТВЕННОЙ ФОРМЫ

*Н.А.Азимова, М.М.Миралимов, Х.Р.Тухтаев*

*Ташкентский фармацевтический институт*

На сегодняшний день большая часть заболеваний связана с нехваткой витаминов, в том числе и никотиновой кислоты. Применяется никотиновая кислота в виде порошка, таблеток и парентерально. Пероральное ее применение вызывает ряд неприятных побочных явлений, внутримышечные инъекции являются болезненными [1,2]. Нами разработаны трансдермальные (пластыреподобные лекарственные формы) терапевтические системы никотиновой кислоты с применением поверхностно-активных веществ (ПАВ), ускоряющих высвобождение действующего вещества из лекарственной формы.

Об особенностях фармакокинетики пластырей можно судить по способности вещества к высвобождению из препарата в опытах *in vitro*. Как правило, чем лучше препарат высвобождается из лекарственной формы, тем выше его концентрация в биологических жидкостях. Поэтому для предварительной оценки биологической доступности никотиновой

кислоты из трансдермальной формы лекарственного вещества исследовали способность препарата к высвобождению в опытах *in vitro*. Определяли способность лекарственного вещества к диализу через полупроницаемую мембрану, в качестве которой использовали целлофановую пленку площадью 20 см<sup>2</sup>. Площадь испытуемого лекарственного вещества 4 см<sup>2</sup>. В качестве рецепторной среды применяли очищенную воду в количестве 100 мл. Диализ проводили при температуре 37±1°C. Пробы диализата отбирали через каждые 0,5, 1, 2, 4, 5, 6, 7, 24 ч. Определяли концентрацию никотиновой кислоты в диализате.

Для количественного анализа содержания никотиновой кислоты в диализате использовали методику спектрофотометрического определения при λ<sub>max</sub> 261 нм. Количество высвободившейся никотиновой кислоты определяли по формуле

$$C\% = \frac{D_1 \cdot C_0 \cdot a \cdot 100 \cdot A}{D_0 \cdot n \cdot b}$$

где  $D_1$  – оптическая плотность испытуемого раствора;  $D_0$  – оптическая плотность раствора стандартного образца;  $C_0$  – концентрация раствора стандартного образца, г/мл;  $A$  – разведение;  $n$  – навеска;  $b$  – объем диализата, отобранный для анализа;  $a$  – общий объем диализной среды.

В таблице представлены результаты исследования, отражающие кинетику высвобождения никотиновой кислоты из составов, приготовленных на основах с добавлением: I – натриевой соли жирных кислот; II – Твин-80; III – состав, не содержащий поверхностно-активных веществ.

Наиболее интенсивно и в больших количествах никотиновая кислота высвобождается из трансдермальной терапевтической системы в составах с добавлением 0,5% Твин-80 (68,10%) и 1% натриевой соли жирных кислот (61,64%) в максимальных концентрациях в течение 4 ч соответственно, тогда как без добавления ПАВ наибольшее высвобождение (71,69%) наблюдается через 5 ч.

Концентрация никотиновой кислоты в диализате

Состав	Концентрация никотиновой кислоты (в %) через							
	0,5 ч	1 ч	2 ч	4 ч	5 ч	6 ч	7 ч	24 ч
I	13.36	31.83	46.62	61.64	41.83	40.64	39.42	56.08
II	25.74	41.68	55.90	68.10	67.25	66.56	65.02	60.88
III	15.00	29.47	49.14	71.47	71.69	71.63	70.39	67.73

Полученные данные могут быть использованы при модификации свойств новых трансдермальных терапевтических систем.

#### ЛИТЕРАТУРА

1. Практикум по биохимии сельскохозяйственных животных, Высшая школа, Москва, 1980, 212.
2. Машковский М. Д. Лекарственные средства. Ч.1, Москва, 1977, 422.