

ФЛЕБОПРОТЕКТОРЫ НА БАЗЕ ФЛАВОНОИДОВ: ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ФОРМЫ, БИОФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА, ТЕХНОЛОГИЧЕСКИЕ ОСОБЕННОСТИ

АВТОРЫ: Э.Ф. Степанова, И.П. Ремезова, А.М. Шевченко, А.В. Морозов, В.К. Мальцева.

ЦЕЛЬ: определить и сравнить динамику растворения лекарственных препаратов, содержащих биофлавоноидные фракции, проанализировать степень микронизации и ее влияние на технологию и биофармацевтические показатели.

МАТЕРИАЛ И МЕТОДЫ

Объекты исследования:

- Детралекс® (таблетки по 1,0 г);
- таблетированные формы препаратов: А, В, С, D, X, Y, Z.

Параметры оценки:

- биофармацевтический профиль высвобождения – показатель, характеризующий уровень высвобождения действующего вещества (диосмина, гесперидина) из лекарственной формы (таблеток) в определенный промежуток времени, – определяли с помощью высокоэффективной жидкостной хроматографии;
- распадаемость, характеристику формы и размера частиц таблеток определяли согласно методикам Государственной фармакопеи XIV издания.

РЕЗУЛЬТАТЫ

1. Изучение биофармацевтического профиля

За 24 часа из таблеток Детралекс® высвобождается 1,26% действующих веществ; из таблеток препарата А – 0,11% действующих веществ; из таблеток препарата В – 0,066% действующих веществ; из таблеток препарата С – 0,103% действующего вещества; из таблеток препарата D – 0,106% действующих веществ; из таблеток препарата X – 0,075% действующих веществ; из таблеток препарата Y – 0,033% действующих веществ; из таблеток препарата Z – 0,202% действующего вещества (рис. 1).

2. Исследование с помощью визуализации частиц таблеток в растворе (оптическая микроскопия) (табл. 1, рис. 2)

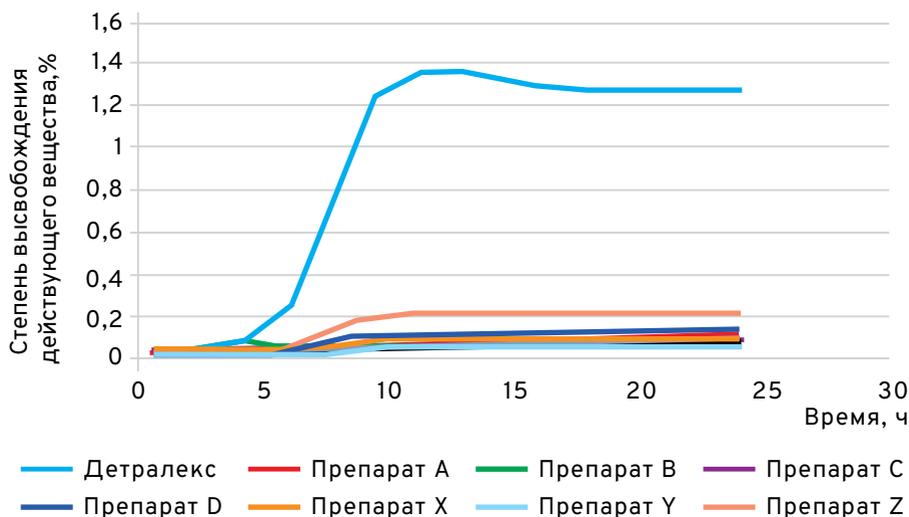
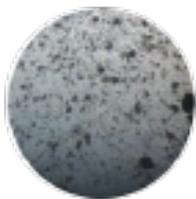


Рис. 1. Результаты изучения биофармацевтического профиля таблеток, содержащих диосмин и гесперидин.

Таблица 1. Сравнение полученных результатов оптической микроскопии

Препарат	Состав	Доза, мг	Размер частиц, мкм	Микронизация
A	Диосмин, гесперидин	900/100	50,1–12,0×10 ⁻³	Нет
B	МОФФ	500	83,4–0,8×10 ⁻³ 56,2–0,42×10 ⁻³	Есть
C	МОФФ	1000	31,2–0,8×10 ⁻³ 21,15–0,3×10 ⁻³	Есть
Y	Диосмин	600	11,3–5,2×10 ⁻³	Нет
D	Диосмин, гесперидин	450/50	12,1–1,8×10 ⁻³	Нет
Z	Диосмин	600	18,2–1,2×10 ⁻³	Нет
X	МОФФ	500	21,1–1,0×10 ⁻³	Есть
Детралекс®	МОФФ	1000	3,3–0,8×10 ⁻³	Есть



Детралекс®



Диосмин 600



Дженерик МОФФ В

Рис. 2. Микроскопия таблеток флеботропных препаратов.

ВЫВОДЫ

Результаты изучения биофармацевтического профиля и, соответственно, разницы в скорости высвобождения свидетельствуют о том, что состав основных веществ препарата Детралекс®, а также особенности его технологии производства (микронизация) обеспечивают в сравнительном аспекте более высокую биодоступность диосмина и гесперидина. Это как минимум **в 6 раз** больше по сравнению с другими анализируемыми препаратами (не более 0,2% в целом), в частности с препаратом Z, и как максимум **в 38 раз** по сравнению с препаратом Y через 24 ч наблюдения.

Результаты оптической микроскопии продемонстрировали выраженное преимущество препарата Детралекс®, заключающееся в наличии самого минимального и однородного размера обнаруженных частиц, что свидетельствует о высоком качестве микронизации данного препарата, его несомненном соответствии требованиям GMP и положительном влиянии на высвобождение.

Степанова Э.Ф., Ремезова И.П., Шевченко А.М. и др. Флеботропекторы на базе флавоноидов: лекарственные формы, биофармацевтическая характеристика, технологические особенности // Фармакология и фармация. 2020. Т. 8, № 6. С. 405–415.