

ОБЩАЯ ФАРМАКОПЕЙНАЯ СТАТЬЯ

Суппозитории

ОФС.1.4.1.0013.15

Взамен ст. ГФ XI

Суппозитории – твердая при комнатной температуре дозированная лекарственная форма, содержащая одно или более действующих веществ, растворенных или диспергированных в подходящей основе, предназначенная для введения в полости тела и расплавляющаяся (растворяющаяся, распадающаяся) при температуре тела.

Различают суппозитории ректальные, вагинальные и палочки.

Ректальные суппозитории обычно имеют коническую или торпедообразную форму и могут использоваться как для обеспечения местного действия, так и для достижения системного эффекта. Масса одного суппозитория должна находиться в пределах от 1 до 4 г. Если масса не указана, то изготавливают суппозитории массой 3 г. Масса суппозитория для детей должна быть от 0,5 до 1,5 г. Максимальный диаметр суппозитория не должен превышать 1,5 см.

Вагинальные суппозитории в основном имеют шарообразную или яйцевидную форму и, как правило, предназначены для местного действия. Масса их должна находиться в пределах от 1,5 до 6 г. Если масса не указана, то вагинальные суппозитории изготавливают массой 4 г.

Палочки имеют форму цилиндра с заостренным концом и диаметром не более 0,2 – 0,5 см. Масса палочки должна быть от 0,5 до 1 г.

Масса и размеры суппозитория должны соответствовать пути их введения.

Основы, используемые при производстве суппозитория, подразделя-

ются на липофильные, гидрофильные и дифильные.

В качестве липофильных основ для получения суппозиторий применяют масло какао, сплавы масла какао с парафином и гидрогенизированными жирами, растительные и животные гидрогенизированные жиры, твердый жир, ланоль, сплавы гидрогенизированных жиров с воском, твердым парафином и другие основы, разрешенные для медицинского применения.

В качестве гидрофильных основ используют желатино-глицериновые гели, сплавы полиэтиленоксидов различных молекулярных масс и другие основы, разрешенные для медицинского применения.

Дифильные основы представляют собой искусственные композиции, обладающие липофильными и гидрофильными свойствами и содержащие в своем составе поверхностно-активные вещества. К дифильным основам относят также сложные эфиры высших жирных кислот типа Витепсол, Лазупол, Суппорин М и другие основы, разрешенные к медицинскому применению.

В зависимости от состояния действующего вещества (растворимое или нерастворимое в суппозиторной основе) суппозитории могут быть гомогенными или гетерогенными.

ОСОБЕННОСТИ ТЕХНОЛОГИИ

Суппозитории в промышленных условиях могут быть получены методом выливания расплавленной массы в формы или методом прессования.

В аптеках суппозитории получают методом ручного формования или выливания.

Наиболее часто применяемым в промышленном производстве является метод выливания расплавленной массы в формы. Производство суппозиторий указанным способом проводится по следующей схеме: приготовление основы, подготовка действующих веществ, введение в основу действующих веществ и гомогенизация, формование и упаковка.

Действующие вещества, при необходимости измельченные и просеянные, вводят непосредственно в основу в виде водного раствора или раствора

в другом подходящем гидрофильном растворителе (для гидрофильных веществ), в виде раствора в жирах или липофильных растворителях (для липофильных веществ) или суспензий растёртых порошков в основах (нерастворимые в воде и жирах).

Термолабильные вещества вводят в основу перед гомогенизацией и формованием при минимально возможной температуре основы, необходимой для сохранения качества веществ и структурных свойств основы.

Метод прессования используется реже. Его преимуществами являются возможность избежать деструкции термолабильных действующих веществ, отсутствие седиментации действующего вещества и предотвращение его несовместимости с расплавленной суппозиторной основой.

В состав суппозитория могут входить различные группы разрешённых для медицинского применения вспомогательных веществ: эмульгаторы, консерванты, антиоксиданты, стабилизаторы и другие.

ИСПЫТАНИЯ

Описание. Суппозитории должны иметь однородную массу, одинаковую форму и обладать твердостью, обеспечивающей удобство применения. Однородность определяют визуально на продольном срезе по отсутствию вкраплений. На срезе допускается наличие воздушного стержня или воронкообразного углубления.

В отдельных случаях допускается наличие вкраплений, что должно быть указано в фармакопейной статье или нормативной документации.

Размер частиц. В случае введения в суппозиторную основу действующего вещества в виде суспензии, необходимо контролировать размер частиц в соответствии с требованиями ОФС «Оптическая микроскопия». Описание подготовки образца и требования приводят в фармакопейной статье или нормативной документации. Размер частиц не должен превышать 100 мкм, если нет других указаний в фармакопейной статье или нормативной документации.

Растворение. Для суппозитория на гидрофильной основе проводят

испытание в соответствии с ОФС «Растворение для твёрдых дозированных лекарственных форм», для суппозиториев на липофильной основе – по ОФС «Растворение для суппозиториев на липофильной основе».

Если предусмотрено это испытание, то испытание на распадаемость не требуется.

Распадаемость. Если суппозитории не предназначены для модифицированного высвобождения, в том числе пролонгированного местного действия, они должны выдерживать испытание на распадаемость в соответствии с ОФС «Распадаемость суппозиториев и вагинальных таблеток». Если не указано иначе в фармакопейной статье или нормативной документации, образцы суппозиториев на липофильной основе должны распадаться через 30 мин; образцы суппозиториев на гидрофильной основе – через 60 мин.

Если для суппозиториев на липофильной основе предусмотрено определение времени полной деформации или температуры плавления, то испытание на распадаемость не требуется.

Температура плавления. Для суппозиториев, полученных на липофильной основе, определяют температуру плавления по методу 2 (ОФС «Температура плавления»), которая не должна превышать 37 °С, если нет других указаний в фармакопейных статьях или нормативной документации. Если определение температуры плавления затруднительно, то определяют время полной деформации.

Время полной деформации. Для суппозиториев на липофильной основе проводят испытание в соответствии с ОФС «Определение времени полной деформации суппозиториев на липофильной основе». Время полной деформации не должно превышать 15 мин, если нет других указаний в фармакопейной статье или нормативной документации. Если предусмотрено это испытание, то испытание на распадаемость не требуется.

Однородность массы. Для суппозиториев проводят определение однородности массы в соответствии с требованиями ОФС «Однородность массы дозированных лекарственных форм». Если предусмотрено определение од-

нородности дозирования, определение однородности массы не требуется.

Однородность дозирования. Для суппозиториев проводят определение однородности дозирования в соответствии с требованиями ОФС «Однородность дозирования».

УПАКОВКА

В соответствии с требованиями ОФС «Лекарственные формы».

МАРКИРОВКА

В соответствии с требованиями ОФС «Лекарственные формы».

ХРАНЕНИЕ

В соответствии с требованиями ОФС «Хранение лекарственных средств». В упаковке, обеспечивающей стабильность в течение указанного срока годности лекарственного препарата, в защищенном от света месте при температуре от 8 до 15 °С, если нет других указаний в фармакопейной статье или нормативной документации.