

فهرست جزوه فارماسیوتیکس ۲ - دانشگاه علوم پزشکی تبریز - ورودی ۹۰

شماره صفحه	تعداد صفحات	کیفیت	مباحث	جلسه	
۲	۹	تایپ شده	اشکال دارویی - انواع قرص	۱	جلسات دکتر جواد زاده
۱۱	۱۰	تایپ شده	اکسیپانت - ریزش پذیری، نقش فرمولاتور در قرص سازی - خصوصیات قرص	۲	
۲۱	۹	تایپ شده	تقسیم بندی اکسیپانت ها - ماشین های قرص سازی - روش های تهیه قرص	۳	
۳۰	۱۲	دست نویس	مرور جلسات قبل - دستگاه های مورد نیاز برای گرانولاسیون مرطوب - اختلاط پودر ها (انواع مخلوط کن ها) - چگونه رهش دارو را کنترل کنیم	۴	
۴۲	۱۳	تایپ شده	تهیه گرانول به روش melt process، دلایل ستفاده فراوان از گرانولاسیون مرطوب در تهیه قرص، خصوصیات اکسیپانت و انواع آن	۵	
۵۵	۶	تایپ شده	گرانولاسیون مرطوب - اشکال SR و FR	۶	
۶۱	۱۴	دست نویس	اشکال دارویی جامد و روکش قرص ها	۷	
۷۵	۷۱	اسکن از نسخه تایپی	تکنولوژی روکش دادن اشکال دارویی جامد	۸	
۱۴۶	۱۸	تایپ شده	اکسیپانت ها	۹	
۱۶۴	۱۴	اسکن از نسخه تایپی	مزایا و معایب کپسول نسبت به سایر اشکال دارویی	۱	جلسات دکتر مقصودی
۱۷۸	۱۰	تایپ شده	پرکردن کپسول	۲	
۱۸۸	۸	تایپ شده	فرمولاسیون کپسول های ژلاتینی، ادامه اکسیپانت ها، ...	۳	
۱۹۶	۸	تایپ شده	کپسول های ژلاتینی نرم و انواع آن	۴	
۲۰۴	۱۴	تایپ شده	متد ساده و نیمه اتوماتیک تولید کپسول ژلاتینی نرم - فرمولاسیون کپسول ژلاتینی نرم	۵	
۲۱۸	۶	تایپ شده	خشک کردن	۶	
۲۲۴	۷	تایپ شده	ادامه مبحث خشک کردن	۷	
۲۳۱	۱۰	تایپ شده	روش های خشک کردن مایعات	۸	
۲۴۱	۶	تایپ شده	اختلاط پودر ها	۹	
۲۴۷	۸	تایپ شده	مخلوط کن ها	۱۰	
۲۵۵	۱۱	دست نویس	مکانیسم های mixing - روش های آنالیز ذره، روش میکروسکوپ، روش Coulter-counter	۱۱	
۲۶۶	۱۱	تایپ شده	روش های دیفراکسیون اشعه لیزر و رسوب ذرات	۱۲	

تعداد جلسات: ۲۱ جلسه تعداد صفحات: ۲۷۶ صفحه

تنظیم فهرست: سامانه پژوهشی ایران پویش iranpuyesh.ir

مرجع تهیه جزوات دانشگاهی، ارائه خدمات پژوهشی و برگزاری کارگاه های علمی-کارآفرینی

بِسْمِ اللّٰهِ الرَّحْمٰنِ الرَّحِیْمِ

گردد ای ۹۰

دکتر جوادزاده

جلسه ۱ فارماسیوتیکس ۲

مبحثی که در فارماسیوتیکس ۲ ان شاء... تدریس خواهد شد، اشکال دارویی جامد (بیشتر، قرص ها و کپسولها) و عملیات داروسازی مثل ریز کردن اندازه ی ذرات، جریان پذیری پودرها. استاد جوادزاده ان شاء... مبحث قرص سازی و Coating را تدریس خواهند نمود (۷-۸ جلسه) (یک واحد آقای دکتر جوادزاده و ۲ واحد خانم دکتر مقصودی)

تعریف قرص: اشکال دارویی جامد تک دوزی هستند که از فشرده شدن یا کمپرسیون مواد مؤثره ی دارویی به اضافه ی برخی اکسیپیانها بدست می آیند.

در پاسخ به سوالی: تک دوز یعنی دوز واحدی رادر داخل یک شکل دارویی فراهم کرده ایم. میشود قرص را- که تک دوز است- نصف کرد ولی نصف، تک دوز نمیشود. کپسول، ساشه و آمپول هم تک دوزند، اما مثلاً میتوان آمپول را هم یک سوم تزریق کرد.

مزیت تک دوز کردن: در صورت تک دوز نبودن، مصرف ناصحیح دارو پیش می آید. مثلاً فرض کنید شربت را می گویند هر ۶ ساعت یک قاشق مرباخوری بخور. قاشق مرباخوری، ۵CC است. ممکن است فرد یک قاشق کوچک بردارد یا متوسط یا سوپخوری بردارد. ثانیاً قاشقهایی که ما داریم استاندارد نیستند و هر کارخانه ای قاشقی برای خود میزند گودی یکی کم و گودی یکی زیاد است. یکی پهن و یکی دراز است. برخی ۲CC، ۳/۵CC، ۶CC و ۵CC هستند. پس ممکن است فرد دارو را بجای ۵CC، ۲CC یا ۷CC و... بخورد. در مورد داروهای معمولی مثل استامینوفن، آموکسی سیلین شاید زیاد تفاوت نداشته باشد اما دارویی مثل دیگلوکسین که شربت آن هم در بازار موجود است، اگر بجای ۵CC، ۱۰CC خورده شود، فرد دچار مشکل میشود و ضربانات قلبش نامنظم میشود. ولی وقتی به فرد گفته میشود که نصف قرص دیگلوکسین را بخور، نصف قرص را میخورد و دوز، دقیقتر میشود. وقتی یک دوز واحدی را داخل یک بسته بندی واحد قرار میدهند و میگویند مثلاً یک قرص بخور، یک قرص میخورد. ولی وقتی به صورت Bulk بسته بندی شده و میگویم یک پیانه بردار و بخور معلوم نیست پیانه اش چگونه خواهد بود.

پس در برخی داروها که حساسند، تک دوزشان را بسته بندی میکنند یعنی Bulk تهیه نمیکنند مگر اینکه مشکل خاصی باشد که نتواند مصرف کند.

مرباخوری: ۵CC، غذاخوری: ۱۰CC

چایخوری: ۲CC، سوپخوری: ۱۵CC

کارخانجات داروسازی خارجی معمولاً چون قاشق مرباخوری ندارند،

Teaspoon مینویسند و داخل پراتز مینویسند معادل ۵ml.

قرصها یکی از پر مصرفترین اشکال دارویی هستند. چرا؟

پایداری فیزیکوشیمیایی (در جزوه ۸۸، در علل پر مصرفی قرصها، پایداری میکروبی هم مطرح شده است) بیشتری نسبت به سایر اشکال دارویی (محلولا، سوسپانسیونها، شیافها، تزریقی) دارند. تاریخ انقضای یک قرص شاید مثلاً ۴-۵-۶ سال باشد اما تاریخ انقضای محلولا، سوسپانسیونها و شیافها از یک و نیم سال بیشتر نمیشود؛ چون قرص، محیط خشکی است که در مجاورت مایعات نیست پس پایداری اش بیشتر میشود.

معمولاً مایعات، محلولا یا سوسپانسیونها را برای چه تهیه میکنیم؟ چرا محلول استامینوفن و سوسپانسیون ایبوپروفن را تهیه میکنیم؟
 ✓ جواب: تا اثر سریعتری داشته باشد.

چرا محلولها و سوسپانسیونها زود اثر میکنند؟ در اشکال دارویی جامد مثل قرصها، تنها شکل قابل جذب دارو، شکل محلول دارو است؛ یعنی باید دارو حل شود تا بتواند جذب گردد. وقتی فرآورده ای را به شکل محلول در می آوریم، فرآیندهای دزنگراسیون و انحلال در آنها حذف می گردد و بلافاصله وارد فرایند جذب خواهد شد پس اثربخشی دارو سریع میشود.

پس یکی از اهداف تهیه سوسپانسیونها چیست؟ ایجاد اثرات سریع دارو.

چرا سایر ضد دردها و ضد تبها، شکل دارویی محلول و سوسپانسیون دارند اما شکل دارویی محلول یا سوسپانسیون

آسپرین وجود ندارد؟ چون پیوند استری دارد، در محیطهای مائی سریعاً هیدرولیز میشود و ساختارش از هم پاشیده میشود. پس به

شکل قرص میسازند تا پایداری فیزیکوشیمیایی اش بیشتر گردد. برای سایر اشکال دارویی هم همینطور است. وقتی آنها را

بصورت قرص درمی آوریم، پایداری فیزیکوشیمیایی فرآورده خیلی بیشتر است.

✓ حمل و نقل آن راحت تر است (در مقایسه با سایر اشکال دارویی). میتوان قرص را در جیب گذاشت و در مسافرت به راحتی قابل حمل است. در مقایسه با سوسپانسیونها و محلولها و فرآورده های تزریقی که باید آمپول و پنبه و الکلی و ... کنارش باشد تا بتوان مصرف کرد و یک فرد ماهر باید باشد که بتواند آن را تزریق کند.

✓ مصرفش راحت است در مقایسه با آمپولها، شیافها و ... یعنی ساده ترین شکل دارویی که قابل مصرف است، قرصها هستند. کیسولها هم همینطورند اما قرصها اندازه شان قابل تحمل تر و ریزتر از کیسولهاست.

یکی از استراتژیهای که کارخانه ها مثلا قرص ایسی پیرامین ۱۰، ۲۵، ۵۰، ۱۰۰ میزنند، این است که از رنگهای مختلف استفاده کنند تا از روی آن قابل تشخیص باشد ولی این دلیل پر مصرفی دارو نیست بلکه یکی از optionهایی است که میتوانیم در مورد قرص ها بکار ببریم.

سخنان استاد در یک بحث کلاسی: برخی ضرورتهای فرمولاسیون ایجاب میکند که دارو بصورت قرص باشد مثل آسپرین که پایداری فیزیکی شیمیاییش ایجاب میکند که قرص باشد نه تزریقی.

✓ نسبت به سایر اشکال دارویی (کیسولها، محلولها، سوسپانسیونها، شیافها، پیچ های پوستی) خیلی ارزان قیمت است و این یک مزیت محسوب میشود.

در جواب یکی از هم کلاسیها: در برخی قرصها، طعم تلخ دارو قابل حس است. اگر ماده ی مؤثره تلخ باشد، مثل پروپرانولول، کلروکین، مترونیدازول - که طعم تلخ و فلزی دارد - این طعم، حس میشود هر چند که این احساس طعم تلخ، نسبت به محلولها و سوسپانسیون ها کمتر است؛ چون تماس با پرزهای چشایی کمتر است. ثانيا در چنین مواردی میتوانیم به راحتی، قرص را بوسیله ی موادی روکش دهیم تا تماسش با پرزهای چشایی به حداقل برسد و باعث شود طعم تلخ داروها کمتر احساس شود.

✓ قرصها را براحتی میتوان در اشکال و سایزهای مختلف ساخت. قرصها تنوع خیلی زیادی دارند. میتوانند به شکل دایره، کپلت (کیسولی شکل)، مدل ستاره ای، مثلثی و هر مدل دیگری باشند. در حالیکه خیلی از فرآورده های دارویی، در این زمینه

محدودیت دارند. مثلا به سوسپانسیون چطور میشود شکل داد؟ یعنی بسته به سلیقه مشتری میتوان اشکال و سایزهای مختلفی از قرصها تهیه کرد.

☑ رساندن دوز دقیقی از دارو: توضیح این قسمت، ضمن توضیح مزیت تک دوز بودن آمده است.

این دلایل باعث شده که قرصها، جزء پرمصرفترین اشکال دارویی محسوب شوند و امروزه هم خیلی از این اشکال دارویی استفاده میشود.

همه انواع قرص: ☐ جویدنی یا مکیدنی: قرص مکیدنی، میتواند موضعی باشد. مثلا در عفونتهای قارچی دهان، میتوان از قرص مکیدنی کلوتریمازول استفاده کرد تا بصورت موضعی اثر کند.

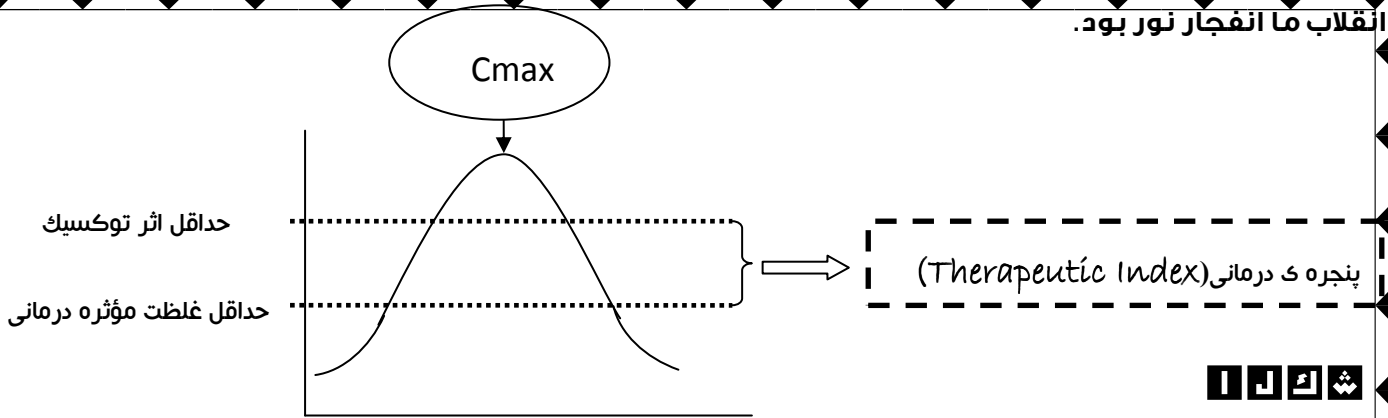
موارد مصرف قرص جویدنی (مثل ضداسیدها و ویتامینها): وقتی اثرات سریع دارو را میخواهیم داشته باشیم چرا که در این قرصها دز تگراسیون را در داخل دهان انجام میدهیم و وارد فرآیند انحلال میشود. معمولا ضددردها و ضدتها را به این صورت میسازند تا سریع اثر کنند. مثلا قرص آسپرین جویدنی و استامینوفن جویدنی.

☐ قرص زیرزبانی: موارد مصرف: ☝ در اثرات سریع. مثلا نیتروگلیسرین زیرزبانی که در آن، در عرض ۵-۳ دقیقه حداکثر اثر دارو دیده میشود. ایزوسورباید دی نترات هم همینطور است. اما نتراتها نیمه عمر خیلی کوتاهی دارند. مثلا نیتروگلیسرین نیمه عمر ۵-۳ دقیقه دارد. یعنی در عرض ۱۵ دقیقه کاملا از خون حذف میشود و به افرادی که آنژین (درد سینه) دارند، توصیه می‌شود برای مصرف قرص زیرزبانشان بدین گونه است که وقتی دچار حمله می‌شوند، قرص را زیرزبان قرار دهند و ۱۵ دقیقه صبر کنند، اگر علائم درد سینه شان کاهش یافت که هیچ، اگر نه، دوباره دوز را تکرار کنند و دوباره ۱۵ دقیقه صبر کنند، اگر تسکین نیافت دوباره میتوانند دوز را تکرار نمایند. این ۱۵ دقیقه بخاطر نیمه عمر خیلی کوتاه داروست.

توضیحات:

موقع مصرف دارو بصورت خوراکی، دارو شروع به جذب میکند، پس از مدتی به حداکثر غلظت (C_{max}) میرسد؛ بعد شروع به افت غلظت میکند. در بدن محدوده ای به نام مینیمم غلظت درمانی (حداقل غلظت مؤثره درمانی) و یک محدوده می‌بینیم اثر توکسیک (حداقل غلظتی که بالاتر از آن، اثرات سمی دارو ظاهر میشود) داریم. برای اینکه یک دارو اثر کند باید در خون به

حداقل غلظت مؤثره ی درمانی برسد و از آن عبور کند. مثلاً شما سرتان درد میکند و بجای مصرف ایبوپروفن ۴۰۰، ۵ CC از شربت ایبوپروفن - که محتوی ۱۰۰mg دارو است - استفاده میکنید یا یک آسپرین بچه مصرف میکنید. چه اتفاقی می افتد؟ اثر نمیکند. چون به حداقل غلظت مؤثره ی درمانی نمی رسد. وقتی هم که غلظت از یک حدی که به نام حداقل غلظت توکسیک شناخته میشود، بالاتر میرود، اثرات سمی دارو ظاهر میشود. البته اثرات سمی دارو با عوارض جانبی دارو (Side effect) فرق میکند. Side effect در غلظتهای درمانی هم اتفاق می افتد مثلاً فردی نیتروگلیسرین مصرف میکند یکی از عوارض جانبی آن، سردردهای ضرباندار می باشد. این عارضه ی جانبی داروست که ناشی از گشادگی عروق است. در غلظت درمانی هم احتمالاً این اثر ظاهر خواهد شد. ولی وقتی از اثرات توکسیک دارو صحبت میکنیم، منظور اینست که غلظت دارو بیش از اندازه شده و اثرات فارماکولوژیک دارو تشدید پیدا کرده است. یعنی میخواستیم دارو، عروق را تا یک حدی گشاد کند تا فشار خون افت یابد، ولی بیش از اندازه گشاده کرده و در نتیجه افت فشار خون زیادی رخ میدهد. در مورد دیگلوکسین هم همینطور، مثلاً میخواستیم دیگلوکسین، قدرت انقباضی قلب را زیاد کند، ولی وقتی غلظتش بالا رفت، بیش از اندازه زیاد میکند. پس قلب خیلی محکم میزند و آریتمی قلبی رخ میدهد و احتمال arrest قلبی (ایست قلبی) وجود دارد. یعنی اثرات فارماکولوژیک دارو تشدید شده است. فاصله ی این دو غلظت (سطح خونی)، Therapeutic Index (پنجره ی درمانی) می باشد. هرچه این تراپیوتیک ایندکس، باریکتر باشد، رساندن غلظت، به غلظت درمانی و نگه داری آن در این سطح، مشکل می باشد. یعنی اگر یک ذره دوز کمتر باشد، اثر نخواهد کرد و اگر کمی دوز بیشتر باشد، اثرات سمی بروز خواهد کرد. مثلاً دیگلوکسین، وارفارین، لیدوکائین، تنوفیلین چنین داروهایی هستند. وارفارین تا یک دوزی خوب است و خاصیت ضد انعقادی دارد ولی اگر یک ذره بیشتر باشد، خونریزی داخلی رخ میدهد و خطرناک است. ولی مثلاً اگر بجای آموکسی سیلین هر ۸ ساعت ۵۰۰mg (یک کپسول)، ۴ کپسول یکجا مصرف شود اتفاق خاصی رخ نمیدهد. چون تراپیوتیک ایندکس خیلی وسیعی دارد و خیلی کم به غلظت توکسیک میرسد. استامینوفن هم پنجره ی وسیعی دارد و اگر بجای ۵۰۰mg، ۱۰۰۰mg مصرف شود، اتفاق خاصی رخ نمیدهد اما در غلظتهای بالای چند گرم، کبد را تخلیه میکند و مسمومیت کبدی شدیدی میدهد چون استامینوفن در کبد توسط اسید گلوکوکورونیک، کونژوگه میشود و دفع میگردد و اگر دوزش خیلی بالا باشد، اسید گلوکوکورونیک موجود در کبد را تخلیه میکند و سمیت شدیدی کبدی میدهد. نیتروگلیسرین هم وقتی مصرف میشود در عرض ۵ دقیقه به حداکثر غلظت پلاسمایی میرسد و بعد از ۱۵ دقیقه به زیر غلظت درمانی افت می یابد پس بعد از ۱۵ دقیقه نیاز هست که دوز بعدی را مصرف کنیم. همه اینها گفته شد تا به این جمله آخر برسیم.



بای پس (Bypass) کردن مسیر کبدی. خیلی از داروها هستند که وقتی بلعیده میشوند برای جذب، وارد ورید باب کبدی میشوند و در کبد توسط آنزیمهای کبدی، متابولیزه میشوند و احتمال دارد از بین بروند. در برخی موارد داروها در اثر این متابولیزه شدن به متابولیتهای فعال تبدیل میشوند و برخی مواقع، به متابولیتهای غیر فعال تبدیل میشوند. در تبدیل داروها به متابولیت فعالشان مشکلی نداریم و اثرات فارماکولوژیک دارو دیده میشود، اما وقتی به متابولیت غیر فعال تبدیل میشوند، اثر دارو از بین خواهد رفت. پس یکی از راههای بای پس کردن مسیر کبدی، در مورد داروهایی که عبور اول کبدی دارند، استفاده از قرص زیرزبانی است. وقتی دارو، وارد سیاهرگهای زیرزبانی میشود، مستقیماً وارد گردش عمومی خون شده و وارد کبد نمیشود که در ابتدا توسط آنزیمهای کبدی از بین برود.

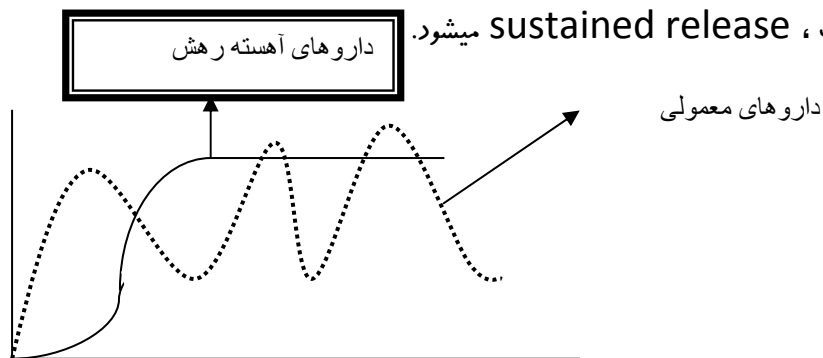
☐ بلعیدنی: ساده ترین قرصها

☐ قرصهای جوشان: وقتی در داخل آب میریزیم میجوشند، چون یک واکنش اسید و باز رخ داده و گاز CO_2 ایجاد میشود و CO_2 وقتی میخواهد از محیط خارج شود حالت جوششی به محلول دست میدهد. علت تهیه ی قرص جوشان: وقتی واکنش اسید و باز رخ میدهد، قرص داخل آب حل شده و شکل محلول بدست می آید و اثرات دارو سریع میشود. مثلاً در بازار، آسپرین جوشان وجود دارد (تا سریعتر اثر کند). از آنجا که در همان لحظه در مجاورت آب قرار میگیرد و بلافاصله مصرف میشود، هیدرولیز نمیکرد.

☐ قرصهای چندلایه مثل آگسار

علل تهیه ی قرصهای چند لایه: **جدا کردن مواد ناسازگار دارویی** (اگر اکسیپانها ناسازگار باشند، براحتی آنها را با اکسیپانهای دیگری جایگزین میکنیم و نیاز به تهیه ی قرص چند لایه نیست). مواد ناسازگار را داخل لایه های مختلف قرار میدهیم و پرس میکنیم و به شکل چند لایه در می آید.

استفاده برای فرمولاسیون قرصهای آهسته رهش (تهیه ی فرآورده ی آهسته رهش یا رهش دوعدی): معمولاً در قرصهای آهسته رهش، میخواهیم اثر دارو به کندی ظاهر شود؛ ولی وقتی اثر دارو خیلی کند ظاهر میشود، لگ تایی برای ایجاد اثراتش ایجاد میشود. یعنی مدتی طول میکشد تا غلظت خونی بالا رود (H₂O₂ H₂CO₃). مثلاً اگر داروی ضددرد، آهسته رهش باشد، شاید ۱-۲-۰.۵ ساعت طول بکشد تا غلظت مؤثره ی خونی را ایجاد کند. پس وقتی بیماری درد یا تشنج دارد و میخواهیم دارو سریع اثر کند، یک قسمت دوز را بصورت fast release در فرمولاسیون قرار میدهیم تا دارو سریع آزاد شود و سریعاً غلظت خونی ایجاد کند، بعد، قسمت sustained release، غلظتهای بعدی دارو را در طولانی مدت تأمین میکند. پس یک قسمت، fast release و یک قسمت، sustained release میشود.



شکل ظاهری و جنبه ی زیبایی: در تمام اشکال دارویی، شکل ظاهری دارو تأثیر دارد. یعنی وقتی میخواهیم از بین دو دارو یکی را انتخاب کنیم، آبی که شکیل تر و زیباتر باشد را انتخاب میکنیم و این امر، از لحاظ روانی هم در مصرف کننده اثر دارد. مثلاً ایوپروفن میخواهیم مصرف کنیم، یکی روکش قندی خورده و شکیل و براق و شیرین است و یکی هم روکش فیلم خورده و سطحش مات است. کدام را انتخاب میکنیم؟ قندی را.

صرفاً برای تفهیم بیشتر: مثلاً فرض کنید شما میخواهید آپارتمانی بخرید. از روی چه چیزی می گوئید که این ساختمان خوب است؟ از روی نما، گچ بریها، رنگ و دکور داخلی قضاوت میکنیم. اما نمیدانیم که در داخل بتن آن درصد سیمان و آب و شن، درست بکار رفته یا نه یا اسکلت فلزی، مناسب جوش خورده است یا نه. یعنی شما از ساختار ساختمان اطلاع ندارید. شاید ساختمانی خیلی شیک باشد، اما با یک زلزله ی کوچک فرویفتند. یعنی آنچه که شما قضاوت میکنید بعنوان فرد غیر حرفه ای و عادی، ظاهر ساختمان است. در مورد اشکال دارویی هم همینطور است. نمیتوان با دیدن فمید که آیا قرص، خوب فرموله شده

و زمان دزنگراسیون و انحلال آن مناسب است یا نه؟ فقط از روی ظاهر قضاوت میکنیم. پس باید شکل دارو زیبا و بسته بندی مناسب باشد. از لحاظ روانی هم ظاهر جذاب تأثیر دارد. مثلاً ممکن است فردی، پلاسبو را که هیچ دارویی ندارد مصرف کند و احساس کند سردردش خوب شد. ✓ پس برای شکیل کردن هم از قرصهای چندلایه میتوان استفاده کرد.

□ قرصهای کاشتنی

□ قرصهای واژینال که بیشتر برای ایجاد اثرات موضعی استفاده میشوند (برای درمان عفونتهای باکتریایی و قارچی و ...). در برخی موارد برای ایجاد اثرات سیستمیک هم میتوان استفاده کرد. یعنی میتوان از مخاط واژن برای ایجاد اثرات سیستمیک دارو استفاده کرد. معمولاً برای فرآورده های کنتراستیتیو که باید جذب شوند و وارد جریان خون شوند (مثلاً هورمونهای حاوی استروژن و پروژسترون) تا اثر کنند که از قرصهای واژینال به این منظور میتوان استفاده کرد. برخی چسب های ضد بارداری را بصورت واژینال استفاده میکنند.

□ قرصهای گونه ای: در داخل گونه استفاده میشوند. بیشتر برای اثرات موضعی استفاده میشوند مثلاً فردی دچار آفت هست میتواند از قرصهای گونه ای استفاده کند. قرصهای گونه ای میتوانند مخاط چسب هم بشوند. یعنی به گونه بچسبند و داروی خود را آزاد کنند. قرصهای گونه ای، یا برای ایجاد اثرات موضعی هستند یا سیستمیک. یعنی برخی داروها را میتوانیم از راه مخاط دهان جذب کرده و وارد گردش خون کنیم. مثلاً نیتروگلیسرین و نیفیدپین؟؟؟ را چنین کرده اند که از مخاط دهان و زیرزبان جذب میشوند و وارد جریان خون میشوند. چون نیتروگلیسرین و نیفیدپین؟؟؟ جزو داروهایی هستند که متابولیسم کبدی خیلی بالایی دارند و از راه مخاط دهان جذب خون خواهند شد.

قرصهای روکشدار: روکشهای معمولی که وجود دارد، □ روکشهای قندی (Sugar coated) و □ روکشهای فیلم هستند و □ Enteric coated که Enteric coated ها، روکشهایی هستند که در محیط معده باز نمیشوند. عامل باز نشدن روکشهای روده ای در معده و باز شدنشان در روده، pH است. برخی پلیمرها در pH اسیدی حل نمیشوند ولی وقتی وارد pH های خنثی و قلیایی میشوند، علت تهیه روکشهای روده ای، اینست که دارو، در محیط اسیدی معده خراب میشود. مثلاً اریترومایسین چنین دارویی است و در محیط اسیدی معده از بین میرود. خیلی از داروها و پروتئینها و پپتیدها نیز همینطورند. چرا واکسنها را بصورت خوراکی نمیسازند؟ چون خیلی از واکسنها پپتید، پروتئین، پلی پپتید هستند و در محیط اسیدی معده، از بین میروند یا اینکه برعکس، دارو بر مخاط معده تأثیر منفی دارد؛ مثلاً NSAID ها (ضد التهابی غیر استروئیدی) و خود

استروئیدها باعث آسیب مخاطات معده میشوند یا برخی داروها مثل KCl چون سریعاً حل میشوند، محرک معده اند و برای اینکه به مخاطات معده آسیبی نرسد، میتوانیم اینها را از معده عبور داده و در روده آزاد کنیم.

مانع تخریب داروهای حساس، در محیط اسیدی معده شویم.

پس، اهداف ساخت قرصهای با روکش روده ای:

مانع اثر سوء برخی داروها بر مخاطات معده شویم.

☑ Sustained release ها، نوع دیگری از اشکال دارویی خوراکی (قرصها) هستند که به تدریج دارو را آزاد میکنند و برای مدتی دارو در خون با غلظت ثابتی وجود دارد؛ یعنی شما بجای اینکه از یک دارو، چندین دوز مصرف کنید، از اینها یک یا دو دوز مصرف میکنید چون در اشکال دارویی معمولی، غلظت، بعد از مصرف، بالا رفته و سپس پایین می آید (شکل ۱ و ۲) و بعد از مصرف دوز بعد، دوباره غلظت خونی، بالا رفته و سپس افت میکند و باز دوز بعدی مصرف میشود و... در این حالت، تعداد دفعات مصرف دارو زیاد میشود و برای مصرف کننده، زیاد مورد پسند نیست؛ مثلاً شما تمایل دارید دارویی را ۴ بار در شبانه روز مصرف کنید یا یکبار؟ مسلماً یکبار خیلی آسان تر است. پس:

☀ در Sustained release ها، تعداد دفعات مصرفی دارو بجای چندبار به یک یا دو بار کاهش می یابد.

☀ وقتی غلظت بالا میرود، احتمال دارد از حداقل غلظت توکسیک بگذرد و وقتی که پایین می آید، ممکن است از حداقل اثر درمانی دارو، کمتر شود. پس همیشه نوسانات غلظت پلاسما، رخ خواهد داد. یعنی یک حالت غیر یکنواختی از اثرات دارو، خواهیم داشت؛ اما اگر غلظت، ثابت و تقریباً یکنواخت باشد، اثرات فارماکولوژیکی، یکنواخت تر خواهد بود و عوارض جانبی کمتر و کارآیی دارو، بیشتر شده و پذیرش بیمار، بیشتر میشود.

Compressed-coated tablets ☑