

MAGISTRALITER PŘÍPRAVA – ANALGETIKA A ANESTETIKA V LOKÁLNÍM PODÁNÍ

MGR. PETR MLYNÁŘ
ÚSTAVNÍ LÉKÁRNA FNKV, PRAHA

Vzhledem k tématickému zaměření tohoto textu se budeme věnovat přípravkům, které působí proti bolesti, a přitom jsou podávány lokálně.

Těchto přípravků je registrována celá řada jako HVLP (např. s nesteroidními antiflogistiky, která mají působit v oblasti aplikace, nebo transdermální systémy s obsahem opioidů – např. fentanyl, který působí po vstřebání centrálně), lze je však připravovat i magistraliter.

PODMÍNKY ÚČINKU

Obecně u topických přípravků, které mají působit lokálně v podkoží nebo naopak systémově, je zejména důležité usnadnit průnik účinné látky bariérovou vrstvou a současně volit takovou recepturu přípravku, aby tuto látku snadno uvolňoval.

Nejlépe se účinná látka vstřebává z nasyceného roztoku. Čím větší je rozdíl mezi koncentrací dané látky v organismu a v přípravku, tím pomaleji dochází k jejich vyrovnání, a tím déle se uvolňuje. Zde ovšem hraje roli i podstatně odlišný objem obou prostředí. Roztok ulpívá na pokožce jen v minimálním množství a zároveň rychle vysychá (neosahuje-li humektant); je proto vhodný hlavně pro lokální využití a k obkladům. Optimální galenickou formou je v tomto případě hydrogel obsahující humektant, eventuálně potřebné solubilizátory, případně v kombinaci s urychlovači penetrace. Díky vnitřní struktuře gelu je v něm pohyblivost molekul rozpuštěné látky podobná jako v roztoku. Účinná látka je tak snadněji dostupná než u jiných lékových forem. Při volbě pomocných látek je třeba brát v úvahu nejen možnosti interakcí s účinnou látkou a látek mezi sebou, ale je vhodné brát v potaz i jejich specifické vlastnosti (např. iontový charakter karboxymethylcelulózy a Carbopolu a u tohoto i citlivost na ionty a pH, u methylcelulózy naopak schopnost tolerovat velké koncentrace iontů a alkoholu atd.). Současně je vhodné uvědomovat si vliv jednotlivých složek na postup přípravy a nevytvářet zbytečně překombinované receptury bez patřičné, a to hlavně praktické znalosti fyzikálně-chemických vlastností surovin.

Další podmínkou optimálního účinku je správná aplikace přípravku. Aby došlo v maximální možné míře k průniku do vnitřního prostředí organismu, je třeba, jak již bylo poznamenáno, překonat bariérovou funkci pokožky. Tu představuje hlavně systém lamelárních micel ve stratu corneou. Po jeho rozrušení a vzniku spojitě disperzního prostředí dochází k průniku účinné látky do jednotlivých kompartmentů díky koncentračnímu spádu. Je samozřejmě vhodné nejdříve odstranit ochrannou vrstvu kožních lipidů. Emulzní systém lze narušit několika způsoby, zde konkrétně dvěma, případně jejich kombinací.

Prvním je použití urychlovačů penetrace. Jsou to látky nejrůznějšího složení, které mění látkové složení emulzního systému bariérové vrstvy a způsobují rozpad micel (v praxi alkohol a éterické oleje). Druhá

možnost je změna poměru složek emulze, což se děje samotným nanesením hydrogelu, které vede k navýšení množství vody ve stratu corneou a rozpadu lamelárních micel. Působení topického přípravku posílíme a stabilizujeme okluzivním obvazem, který zabrání vysychání gelu a perspiraci pokožky. Tím se navýší množství nakumulované vody ve stratu corneou a posílí se destrukce bariérové vrstvy, a tím i účinek preparátu.

LIDOCAINOVÝ GEL 4%

| | | |
|--|-----------------------------------|---------|
| Kód pojišťovny | RECEPT série UM 0681607 | poř. č. |
| Příjmení a jméno | | |
| Číslo pojištěnce | | f. |
| Bydliště (adresa) | | |
| I C P | Rp. | Cena |
| | Sk. Kód | |
| | Lidocaini hydrochlor. | 0,8 |
| | Levomentholi | 0,2 |
| | Carbomera 980 | 0,16 |
| | Propylenglycoli | 3,77 |
| | Aquae purificatae ad | 20,00 |
| | M. f. gel | |
| | D. S. K potírání bolestivých míst | |
| I C P | Rp. | |
| | Sk. Kód | |
| razítka zdrav. zařízení, jmenovka a podpis lékaře | | |
| Připravil: | | Vydal: |



mentol



rozetřený mentol a lidokain



hotový gel

POSTUP PŘÍPRAVY

Na rozdíl od mezokainového gelu, kde se jako gelotvorný základ používá modifikovaná celulóza (např. metylcelulóza), lze použít i karbopolový gel.

Navážíme lidocain a mentol. Po jejich smísení vznikne tekutá eutektická směs. Do této směsi přidáme propylenglycol, potom vodu a pečlivě promícháme. Na povrch opatrně nasypeme v rovnoměrné vrstvě carbopol, promícháme a necháme asi 1 hodinu bobtnat. Tuto směs již není nutné upravovat (pH), gel vznikne i bez úpravy. Po minimálně hodině bobtnání ve vhodném zařízení gel zhomogenizujeme.

MORFINOVÝ GEL

Jako další příklad lokálně používaného analgetika uvádíme tentokrát netradičně gel připravovaný a používaný v zahraničí v terapii bolesti, a to morfinový gel. Jak je známo, morfin působí v CNS na μ -receptory, jeho lokální účinek není znám a popsán i přesto, že je úspěšně používán. S morfinovým gelem v různých koncentracích také probíhaly klinické studie v různých fázích. Příprava je analogická jako v předchozím případě, jen je nutné nakonec upravit pH například trolaminem, aby vznikl gel.

(Zdroj: Krajnka M, Zylliczb Z, Finlayc I et al. Potential use of topical opioids in paliativ care – Pain 80:1999)

Literatura u autora

| | | |
|--|--|-------------------|
| Kód pojišťovny | RECEPT | poř. č. |
| série UM | 0681607 | |
| Příjmení a jméno | | |
| Číslo pojištěnce | | f. |
| Bydliště (adresa) | | |
| I | Rp. | Cena |
| C | Sk. Kód | |
| P | Morphini chloridi | 0,02 |
| | NaEDTA | 0,02 |
| | Carbomera 980 | 0,2 |
| | Trolamini | 0,2 |
| | Propylenglycoli | 0,17 |
| | Aquae purificatae | ad 20,0 |
| | M. f. gel | |
| | D. S. 1 cm proužek gelu vtřít do bolestivého místa | |
| I | Rp. | |
| C | Sk. Kód | |
| P | | |
| razítko zdrav. zařízení, jmenovka a podpis lékaře | | Připravil: Vydal: |

Inzerce

Čištěná voda nejen pro magistraliter přípravu



Aqua purificata Bag in Box 5 l

Snadno, rychle a efektivně

- ✓ plně nahrazuje výrobu vlastní čištené vody v lékárnách!
- ✓ vhodná pro magistraliter přípravu léčiv a k oplachům
- ✓ prodloužená doba spotřeby **3 měsíce** po otevření
- ✓ skladování v originálních snadno omyvatelných obalech po dobu **24 měsíců**
- ✓ **nulové výrobní náklady!**

fagron.cz

FAGRON, a.s., Holická 1098/31M, 772 00 Olomouc, Česká republika
e-mail: obchod@fagron.cz, tel.: +420 585 222 590, fax: +420 585 226 521



**Garantovaná kvalita
dle Českého a Evropského
lékopisu!**