

| | | | |
|---|--|---|------------------------------------|
| Tiedekunta/Osasto — Fakultet/Section Matemaattis-luonnont. tiedek. | | Laitos — Institution Farmasian laitos | |
| Tekijä — Författare Sari Rautio | | | |
| Työn nimi — Arbets titel Eräiden enteropolymeerien vaikutus paikallisesti paksusuolella vaikuttavan lääkeaineen kontrolloituun vapautumiseen matriksirakeista | | | |
| Oppiaine — Läroämne Biofarmasia | | | |
| Työn laji — Arbets art Kokeellinen pro gradu | | Aika — Datum 7.12.1993 | Sivumäärä — Sidoantal 47 |
| Tiivistelmä — Referat <p>Työn tarkoituksena oli selvittää, miten muutamat eri enteropolymeerit vaikuttavat veteen niukkaliukoisen, paksusuolella paikallisesti vaikuttavan lääkeaineen vapautumiseen matriksirakeista. Lääkeaineen tulisi vapautua vasta paksusuolella tai ohutsuolen loppupäässä, eli pH-alueella noin 6-7. Tutkimuksissa käytetyt enteromateriaalit olivat suhteellisen korkeissa pH-arvoissa liukenevia polymeerejä: Eudragit® L 100 ja S 100, hydroksipropyylimetyyliselluloosa-asetaatiksiinaatti (HPMCAS-MF ja -HF) sekä selluloosa-asetaatiftalaatti (CAP). Rakeista tutkittiin in vitro, missä pH:ssa malliaineena käytetyn furosemidin vapautuminen on nopeinta. Kahdesta rae- ja yhdestä tablettiformulaatiosta tehtiin röntgenkokeet koirilla. Kahdesta raeformulaatiosta tehtiin myös imeytymiskokeet ihmisillä.</p> <p>In vitro -kokeiden perusteella voitaisiin olettaa, että Eudragit® S 100:aa tai HPMCAS-HF:ää sisältäviä matriksirakeita olisi mahdollista käyttää kohdentamaan lääkeaine ohutsuolen loppupäähän tai paksusuoleen. Lääkeaineen vapautumisnopeus molemmista raeformulaatioista oli suurimmillaan samassa pH:ssa (6,8), mutta HPMCAS-HF -rakeista vapautuminen oli pitkitetympää. Enteropolymeerin osuuden muuttaminen vaikutti vapautumisnopeuteen; polymeerin osuuden kasvu hidasti lääkeaineen vapautumista. Eudragit® S -tableteista vapautumisnopeus oli suurimmillaan vasta pH:ssa 7,2, joka saattaa olla liian korkea ajatellen elimistön pH-arvoja.</p> <p>Tehdyistä röntgenkokeista koirilla ei käynyt ilmi, liukenivatko rakeet ja tabletit kokonaan ruuansulatuskanavassa, koska kokeen kesto jäi liian lyhyeksi. Ihmisillä tehdyistä imeytymiskokeista havaittiin, että lääkeaineen vapautuminen rakeista oli liian nopeaa, eli valmisteet eivät toimineet toivotulla tavalla in vivo.</p> | | | |
| Avainsanat — Nyckelord Eudragit, HPMCAS, CAP, furosemidi, enteropolymeeri, matriksirae, paksusuoli, kontrolloitu vapautuminen | | | |
| Sairaalapäässä — Förhållingställe Farmasian laitos, biofarmasian ja farmakokinetiikan osasto | | | |
| Muuta tieto a — Övriga uppgifter | | | |