

## Farmaceutické pomocné látky (PL)

(angl. Pharmaceutical Excipients)

= látky obsažené v lékových přípravcích, jež nejsou nositeli účinku

- nutné pro formulaci (vytvoření) lékové formy (LF), mohou ovlivňovat biologickou dostupnost účinných látek
- technické pomocné látky – použity při výrobě LF, v konečném přípravku nejsou přítomny (typicky rozpouštědla, která se v průběhu výroby odpaří)
- lékopisy: požadavky na PL z hlediska kvality včetně čistoty jsou stejné jako na léčiva (účinné látky) – ČL 2009 – obecný článek *Corpora ad usum pharmaceuticum*
- definice PL v ČsL 4 (platil 1987 – 1996): PL jsou chemicky jednotné či nejjednotné látky popř. jejich směsi potřebné k výrobě nebo přípravě léčivých přípravků a léků, které jsou buď jejich součástí (farmaceutické pomocné látky), nebo v hotovém přípravku a léku nejsou obsaženy (technické pomocné látky).

## Rozdělení PL dle použití

0. PL konstitutivní – vytvářejí „habitus“ lékové formy

1. PL stabilizující

2.1 Stabilizátory agregátových vlastností disperzí – tenzidy, látky zvyšující viskozitu

2.2 Stabilizátory látkového složení lékových přípravků

2.2.1 Antioxidanty

2.2.2 Antimikrobiální konzervanty

3. Látky korigující organoleptické vlastnosti léčivých přípravků

3.1 Korigencia chuti

3.2 Korigencia vůně

3.3 Korigencia barvy – barviva

4. Látky ovlivňující biologickou dostupnost účinných látek – urychlovače průniku přes bariéry organismu

5. Technické PL

## Rozdělení PL dle chemické struktury

- uhlovodíky – alkany – vyšší homology – konstitutivní PL (vazelína – masťový základ); nižší homology – benzín – denaturace lihu (*Spiritus benzino denaturatus*), terpeny – korigencia vůně
- alkoholy – konst. PL - nižší (ethanol, propan-2-ol, propan-1,2-diol, glycerol) – rozpouštědla, kosolventy, využití antinikrob. vlastností; vyšší (dodekanol – oktadekanol) – součásti masťových, krémových, čípkových základů, emulgátory o/v (též cholesterol); alifaticko-aromatické – konzervanty; „cukerné“ = polyoly (sorbitol, mannitol, xylitol) – korigencia chuti, konst. PL (sirupy)
- fenoly – antimikrob. konzervanty (vakcíny)
- ethery – diethylether – tech. PL, polymerní – polyoxoethyleny (= polyethylenglykoly) – konst. PL – hydrofil. masť. a krém. základ aj.
- ketony – aceton – tech. PL, terpenické – korigencia vůně
- karbox. kyseliny – nižší – úprava pH, hydroxykyseliny (vinná, citronová) – chelatační činidla, synergické látky k antioxidantům, též konst. PL – složka šumivých tablet; vyšší – konst. PL - masťové základy (stearová...), emulgátory (zejm. jako soli - mýdla)
- estery – ethylacetát – rozpouštědlo, derivans, další nižší – korigencia vůně; vyšší – konst. PL – čípkové a masťové základy
- sacharidy – monosacharidy – isotonizace infundabilií (zároveň výživa) – glukosa, disacharidy – konst. PL (laktosa – tbl., plnidlo cps.; sacharosa – sirupy), korigencia chuti; cykl. oligosacharidy (cyklodextriny) – zlepšují průnik léčiv bariérami a snižují dráždivost, polysacharidy – konst. PL (celulosa – tbl.), látky regulující uvolňování z tbl. (rozvolňovadla-škrob, etherifikované polysacharidy – hydroxypropylcelulosa), PL stabilizující suspenze a emulze zvýšením viskozity (etherifikované polysacharidy – methylcelulosa, karboxymethylcelulosa...)
- sulfoxidy – dimethylsulfoxid (DMSO) – rozpouštědlo, kosolvens, urychlovač transdermálního průniku
- sulfáty a sulfonáty – aniontové tenzidy – emulgátory a stabilizátory suspenzí
- aj.

## Rozdělení PL dle „kvantifikovatelnosti účinku“

- látky bez vlastního (kvantitativně vyjádřitelného) účinku – konst. PL

- látky s vlastním kvantifikovatelným účinkem:

- ★ antimikrobiální konzervanty (MIC)

- ★ antioxidanty (totální antioxidační kapacita aj.)

- ★ korigencia chuti – sladidla (sladivost ve srovnání se sacharosou)

- ★ tenzidy (HLB)

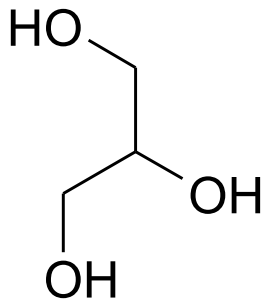
- ★ urychlovače průniku přes bariéry organismu (např. transdermální) – akcelerační poměr AP (ER) aj.

- ★ barviva – objektivní vyjádření barvy (barevnosti) v systémech souřadnic (např. CIELAB), nebo jinak pomocí VIS spekter ( $\lambda_{\max}$ ,  $\varepsilon$ )

- ★ aj.

## Látky na pomezí PL a léčiv

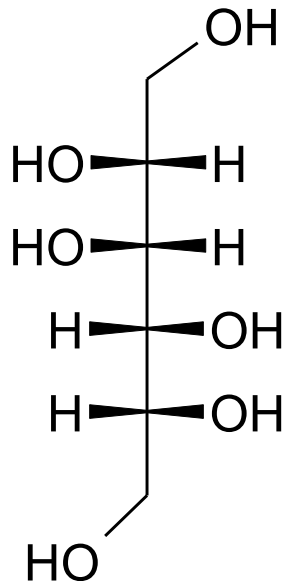
### Cukerné alkoholy



#### glycerol

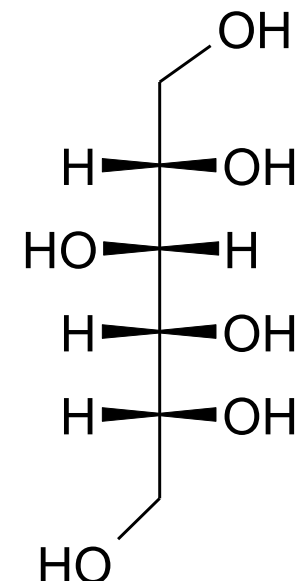
*Suppositoria glycerini*

- kosolvens, zvlhčovač  
v topických přípravcích
- při podání *per rectum*  
laxans



#### D-mannitol

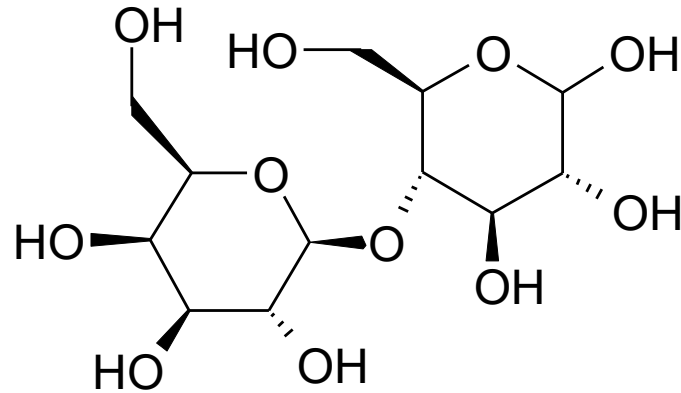
- korigencia chuti – sladidla
- při podání *p. o.* osmotická laxativa



#### D-sorbitol

syn. **D-glucitol**  
Yal<sup>®</sup> sol.

## Látky na pomezí PL a léčiv



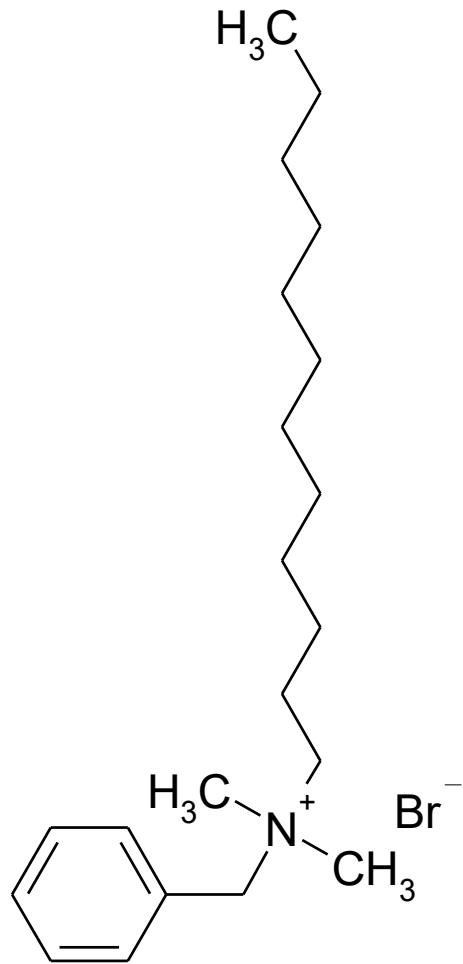
### **laktosa** (*Saccharum lactis*)

4-O- $\beta$ -D-galaktopyranosyl-D-glukosa

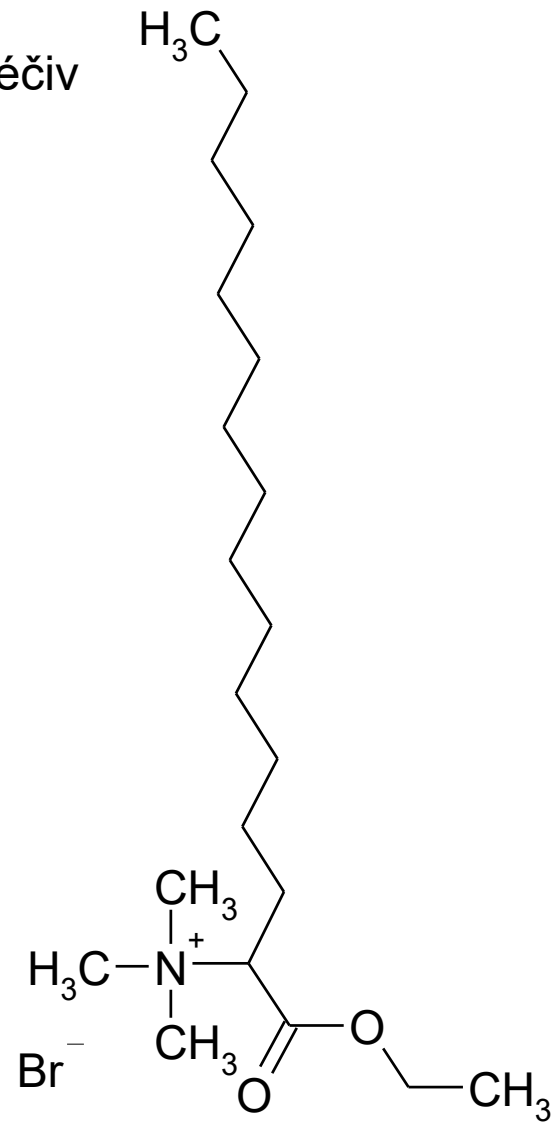
★ konst. PL chem. značně inertní – složka tbl.,  
plnidlo cps.

★ ve vyšších dávkách v roztoku *p. o. laxans*

Látky na pomezí PL a léčiv



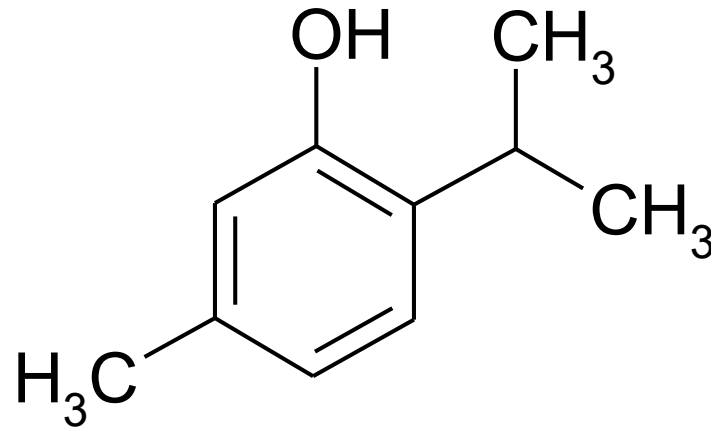
benzododecinium-bromid  
Ajatin<sup>®</sup>



karbethopendecinium-bromid  
Septonex<sup>®</sup>

- ◆ tenzidy, emulgátory
- ◆ antimikrobiální konzervanty
- ◆ dezinficiencia, antiseptika

## Látky na pomezí PL a léčiv



### **thymol**

2-isopropyl-5-methylfenol

*Thymolum* ČL 2009

- ◆ složka silic rodu *Thymus*
- ◆ antimikrobiální konzervans s bakterio- a fungistatickým účinkem
- ◆ expektorans

Thymomel sir.®