

# Plasticky deformovatelné léčivé přípravky

- ✓ **Unguenta** – Masti – topické přípravky,
- ✓ **Cremares** – Krémy – topické přípravky obsahující více než 10% vody,
- ✓ **Gelata** – Gely – topické přípravky obsahující gelotvorné látky,
- ✓ **Pastae** – Pasty – topické přípravky obsahující více než 25% pevných látek.

## Unguenta – masti

Jsou to plasticky deformovatelné léčivé přípravky při teplotě těla měknoucí, určené k aplikaci na zdravou, poraněnou nebo patologicky změněnou kůži, sliznici nebo tkáň.

Masti se zpravidla skládají z léčivých látek a masťových základů. Léčivé látky jsou v masťovém základu různě dispergovány a podle toho se dělí na:

1. **Roztokové masti** – léčivé látky jsou v masťovém základu rozpuštěny (jednofázové masti).
2. **Suspenní masti** – léčivé látky jsou v masťovém základu suspendovány (dvoufázové masti).
3. **Emulzní masti** – léčivé látky jsou v masťovém základu emulgovány (dvoufázové masti).
4. **Suspenně-emulzní masti** – léčivé látky jsou suspendovány v emulzní masti (třífázové masti).

### Účinné látky:

Volba účinné látky závisí na terapeutickém užití a na místě aplikace. Z toho plyne široké spektrum používaných látek. Patří sem zejména látky ze skupiny desinficiencí, antibiotik, kortikoidů, antiflogistik, analgetik, keratolytik, keratoplastik a řada dalších farmakologicky účinných látek.

### Pomocné látky:

Do široké skupiny pomocných látek se zařazují také masťové základy, které se významně podílejí na terapeutickém účinku léčiva. Na masťovém základu totiž závisí, zda bude účinek povrchový, penetrační nebo resorpční. Masťový základ může značně ovlivnit i délku účinku léčiva, obsaženého v masti. Dále ovlivňuje vzhled, konzistenci, strukturu, přilnavost a stálost mastí. Dalšími látkami jsou emulgátory (lanalkol, cholesterol, cetylalkohol, sorbimakrogoly ad.), antioxidanty (propylgalát, tokoferol-acetát ad.), antimikrobiální látky (parabeny).

### **Mast'ové základy**

Jsou jednofázové, opticky homogenní systémy, které podle povahy složek jsou buď hydrofobní (lipofilní), nebo hydrofilní (lipofobní).

## **Lipofilní mast'ové základy**

Je to skupina mast'ových základů obsahující alifatické uhlovodíky, tuky, oleje, vosky, vyšší alifatické alkoholy, a to buď samostatně, nebo ve směsi. Neobsahují emulgátory, takže mohou absorbovat a udržet pouze malé množství vody.

## **Uhlovodíkové oleomast'ové základy**

Jsou to směsi přírodních nebo umělých pevných a kapalných alifatických uhlovodíků. Nerozpouštějí se ve vodě a nemísí se s ní, rozpouštějí se v organických nepolárních rozpouštědlech (chloroform, ether) a mísí se s rostlinnými oleji. Vodné číslo mají nejvýše 10, proto se kombinují s emulgátory za vzniku emulzních mast'ových základů.

*Pozn.: **Vodné číslo** udává nejvyšší množství vody, které může trvale vázat 100 g bezvodého mast'ového základu při pokojové teplotě, tj. 20 °C.*

Uhlovodíkové mast'ové základy jsou stálé a dobře se snášejí s většinou léčivých látek. Na kůži se dobře roztírají, ale nevstřebávají se do ní! Jsou proto vhodné k přípravě mastí s ochranným nebo povrchovým účinkem. Jejich terapeutickou nevhodou je tvorba poměrně silné vrstvy na kůži, která brání kožnímu dýchání a odpařování vody z jejího povrchu, také špatná rozpustnost většiny léčiv a jejich pomalé uvolňování.

### **VASELINUM – Vazelína**

Je to čištěná směs polotuhých alifatických uhlovodíků  $C_{16}$  a vyšší (parafinu a viskózního oleje), získaných frakční destilací ropy. Čištění se provádí kyselinou sírovou a adsorpčními prostředky. Podle stupně vyčištění se rozeznává žlutá a bílá vazelína. Má teplotu tání v rozmezí 37–75 °C. Je chemicky i fyzikálně velmi stálá. Z léčiv se ve vazelíně rozpouštějí kafir, menthol a methylester kyseliny salicylové, mísí se s ní éterické oleje (silice), omezeně pak mastné oleje. Lze do ní zapracovat ichtamol, nemísí se však s kamenouhelným dehtem.

### **ČL 2009 uvádí:**

#### **Vaselinum album – Vazelína bílá**

Bílá nebo téměř bílá, v tenké vrstvě průsvitná, vazká, mast'ová, homogenní hmota, bez chuti a zápachu. Jedná se o čištěnou a vyšším stupněm vybělenou směs polotuhých nasycených uhlovodíků z ropy. Teplota tání se pohybuje v rozmezí 38–60 °C. Vodné číslo je v rozmezí 7,8–5,6, pro zpracování vody nebo vodných léčiv se však z důvodu stability emulzního systému vždy doporučuje přísada emulgátoru.

Má účinek emolientní, lubrikační, na kůži okluzivní (uzavírací). Používá se především jako masťový základ s účinkem krycím a ochranným. V kombinaci s emulgátory se používá k přípravě emulgujících základů, které jsou schopné pojmut hydrofilní kapaliny. Slouží jako základ pro oční masti a masti určené do bércových vředů.

#### **Vaselinum flavum** – Vazelína žlutá

Žlutá, až slabě hnědožlutá, v tenké vrstvě průsvitná, vazká, masťová, homogenní hmota, bez chuti, slabého charakteristického zápachu. Jedná se o čištěnou, částečně vybělenou směs polotuhých nasycených uhlovodíků z ropy. V malém množství obsahuje i aromatické uhlovodíky, které mohou způsobit iritaci. Vlastnosti i použití má stejné jako bílá vazelína.

*Pozn.: Používá se vždy, je-li předepsána vazelína bez bližší specifikace, kromě případů, kdy je přípravek určen přímo na erodované plochy nebo oční sliznici!*

#### **PARAFFINUM** – Parafín

Získává se z dalších frakcí ropy. Je to čištěná směs kapalných nasycených uhlovodíků. Bývá součástí topických polotuhých i tekutých přípravků. Často se používá jako pomocná látka k předmísení rozdrobených pevných látek při přípravě suspenzních mastí, oleopast a oleokrémů, aby se zajistilo rovnoměrné rozptýlení suspendovaného léčiva v přípravku. Samostatně se k aplikaci na kůži používá jako omývadlo past nebo tekutých pudrů, když pacient nesnáší rostlinné oleje. Nesmí se používat do nosních přípravků, protože poškozuje ciliární (řasinkový) aparát a při vdechnutí může způsobit lipidní pneumonii. Podrobné informace viz *Solutiones* (netěkavá rozpouštědla).

#### **ČL 2009** uvádí:

**Paraffinum liquidum** – Tekutý parafín, **Paraffinum perliquidum** – Tekutý parafín lehký a **Paraffinum solidum** – Tvrdý parafín.

## **Tuky a oleje**

Jsou to směsi esterů vyšších nenasyčených a nasycených mastných kyselin s glycerolem (triacylglyceroly). Pro farmaceutické účely se získávají z živočišných a rostlinných orgánů. Na poměru glyceridů nasycených a nenasyčených mastných kyselin závisí konzistence tuků – vyjadřují to i užívané názvy: lůj (*sebum*), sádlo (*adeps*) a olej (*oleum*).

*Pozn.: Jelení lůj – směs triglyceridů mastných kyselin s parafíny, parfémem a jinými pomocnými látkami.*

Jejich nevýhodou je chemická nestálost. Snadno totiž dochází k oxidaci tuků a olejů vzdušným kyslíkem za katalytického působení světla, tepla, vody a těžkých kovů. Tento proces je znám jako žluknutí tuků – pro více informací viz *Olea medicata*. Tomuto jevu se předchází stabilizací pomocí antioxidantů.

Výhodou tuků a olejů je lepší roztíratelnost na kůži. Tenčí vrstva nebrání kožnímu dýchání, podporuje epitelizaci a působí jak penetračně, tak i resorpčně.

**ČL 2009 uvádí tyto tuky:****Adeps suillus** – Vepřové sádlo

Je to tuk získaný tavením při 75–100 °C čerstvé zdravé tukové tkáně vepřů zbavené vody a bílkovin, druhu *Sus scrofa* – Prase divoké (*Suidae*) nebo *Sus domesticus* – Prase domácí (*Suidae*). Složením je příbuzný tuku lidského těla, dobře se vstřebává. Vlastnostmi to je homogenní bílá nebo lehce nažloutlá snadno roztíratelná hmota s velmi slabým charakteristickým zápachem, jeho teplota tání je 36–40 °C. Je prakticky nerozpustný ve vodě a těžce rozpustný v 96% ethanolu, velmi snadno v etheru a petroletheru. Nevýhodou je jeho malá schopnost přijímat vodu a snadná oxidace i přes obsah antioxidačních látek.



*Pozn.: Při zpracovávání vepřového sádla se nedoporučuje jeho zahřívání na teploty vyšší než 50 °C – po zchladnutí totiž vzniká zrnitá nehomogenní hmota.*

**Adeps solidus** (syn. *Adeps neutralis*) – Ztužený tuk

Je to směs mono-, di – a triacylglycerolů, která se získává esterifikací nasycených vyšších mastných kyselin glycerolem nebo trans-esterifikací tuků přírodního původu a následnou rafinací. Různé druhy ztuženého tuku se liší svou teplotou tání, hydroxylovým číslem a číslem zmýdelnění. Jde o bílou až nažloutlou, křehkou voskovitou hmotu slabého charakteristického zápachu, bez chuti. Teplota tání se uvádí v rozmezí 30–45 °C, pro čípkové základy je žádoucí mezi 33 a 35 °C. Podle obsahu jednotlivých acylglycerolů je schopen pojmout určité omezené množství vody a jiných hydrofilních tekutin. Je snadno rozpustný v etheru, chloroformu, těžce rozpustný v ethanolu 96 %, prakticky nerozpustný ve vodě.

Využívá se jako indiferentní pomocná látka; čípkový základ nebo ztužující složka masťových základů na bázi triacylglycerolů. Má promašťující a emolientní účinek.

*Pozn.: Hydroxylové číslo  $I_{OH}$  udává množství hydroxidu draselného v miligramech potřebné k neutralizaci kyseliny vázané při acetylaci 1 g látky.*

*Číslo zmýdelnění  $I_S$  udává množství hydroxidu draselného v miligramech potřebné k neutralizaci volných kyselin a ke zmýdelnění esterů obsažených v 1 g látky.*

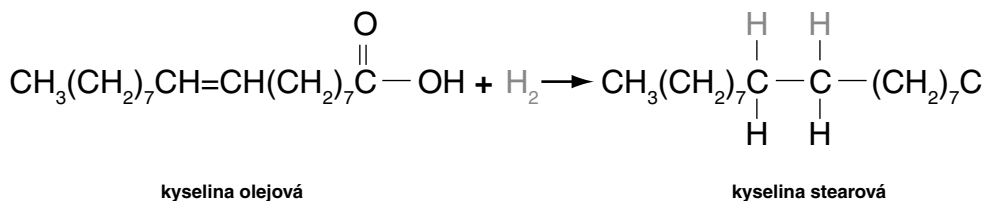
**Oficinální tuk uvedený v ČsL 4:**

**Adeps suillus stabilisatus** – Stabilizované vepřové sádlo (0,1 % galanu propylnatého)

K úpravě konzistence masťových základů se používají nejčastěji tyto oleje uváděné ČL 2009: *Helianthi oleum*, *Lini oleum* a *Olivae oleum*. Podrobné informace – viz *Olea medicata*.

**Ztužování tuků**

Tuky a oleje se ztužují katalytickou hydrogenací dvojných vazeb nenasycených mastných kyselin. Při tomto procesu vzniká např. z nenasycené kyseliny olejové nasycená kyselina stearová, která je tuhé konzistence. Ztužením tuků se mění jejich fyzikální i chemické vlastnosti. V lékopisech nebyly ztužené oleje nikdy obsaženy, ČL 2009 není výjimkou.



*Hydrogenace kyseliny olejové*

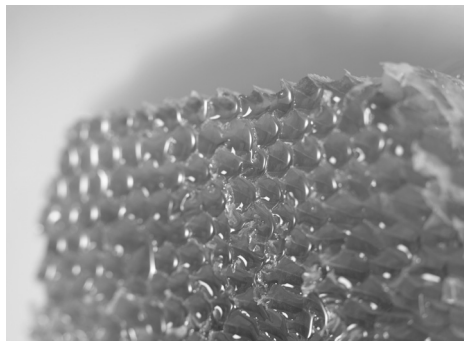
**Vosky**

Jsou to estery vyšších jednosytných alkoholů s vyššími kyselinami. Používají se na úpravu konzistence lipofilních masťových základů. Přijímají lépe vodu a působí jako nepravé emulgátory.

**ČL 2009 uvádí:**

**Cera flava** – Žlutý vosk

Je to včelí vosk, získaný roztavením stěn pláství vytvořených včelou medonosnou – *Apis mellifera* (*Apidae*) v horké vodě a zbavený cizích příměsí.



**Vznik** – Včelí vosk je přirozený produkt, který vzniká metabolickou přestavbou medu a pylu v těle některých druhů včel. U včely medonosné je producentem dělnice ve 12. až 18. dni jejího života. Při tvorbě díla včela doslova potí vosk na tzv. voskových zrcátkách na spodní straně 3.–6. článku (tergit) zadečku. Chitinová stěna zrcátek je perforovaná mikroskopickými otvory, jimiž po zvýšené námaze tryská sekret jako čerstvý vosk. Na vzduchu tuhne a ve formě šupinky přebírá anatomický tvar zrcátka. I když se šupinka odloupne, zůstává částečně zasunutá pod přečnívajícím okrajem sousedního článku zadečku. Hmotnost jedné šupinky 0,5 mm silné se pohybuje v rozmezí 0,8–2 mg. Energetická (metabolická) náročnost u produkce vosku je vysoká. Ke vzniku 1 kg vosku včely spotřebují 3,5–10 kg medu a kolem 50 g pylu. Včela šupinku podle potřeby sbírá kartáčkem třetího páru noh a zpracovává kusadly. Vzniká bílá tvarohovitá hmota. Působením slin se stává vláčnou za předpokladu, že teplota prostředí je 33 °C až 36 °C.

Vosk obsahuje až 284 různých složek. Ne všechny byly identifikovány, ale asi 111 z nich jsou látky těkavé. Z kvantitativního hlediska jsou nejvýznamnější monoestery a diestery nasycených a nenasycených uhlovodíků, volných mastných kyselin a hydroxypolyesterů. Hlavními složkami jsou estery mastných kyselin (zejména myricylester kyseliny palmitové), hlavní kyselinou je kyselina cerotová a neocerotová, hlavními alkoholy jsou myricylalkohol a cerylalkohol.

Vlastnostmi to jsou žluté nebo světlehnědé kousky nebo destičky, jemně zrnitého matného lomu; zahřátím v dlani měknou a stávají se tvárnými. Jsou bez chuti, ale mají charakteristickou vůni po medu. Je prakticky nerozpustný ve vodě a v ethanolu (částečně se rozpouští v horkém); je rozpustný v olejích a silicích.

#### **Cera alba** – Bílý vosk

Je to včelí vosk získaný bělením žlutého včelího vosku na slunci. Jsou to bílé nebo nažloutlé kousky, destičky nebo pecičky, bez chuti, slabého medového zápachu. Je prakticky nerozpustný ve vodě a v ethanolu (v horkém se částečně rozpouští); zahřátím se rozpouští v olejích a silicích; dobře rozpustný je v etheru a chloroformu. Teplota tání je 62–66 °C.

Využívá se jako ztužovadlo, stabilizátor emulzí, slabý emulgátor v/o. Oleokrémy s bílým voskem vykazují chladivý efekt.

**Pozor! U osob alergických na včelí produkty vosky vyvolávají projevy hypersenzibilizace!**

#### **Oficinální vosk uvedený v ČsL 4:**

##### **Cetaceum** – Vorvaňovina

Je to vyčištěný pevný podíl tukovitě voskové směsi, obsažené zejména v dutinách hlavy vorvaňů, zvláště druhu *Physeter catodin* – Vorvaň tuponosý (*Physeteridae*) – viz příloha.

Vlastnostmi to je bílá, hrubě lístkovitě krystalická, perleťově lesklá, na omak mastná hmota slabého charakteristického zápachu a mdlé chuti. Po navlhčení 96% ethanolem ji lze rozetřít na prášek. Je prakticky nerozpustná ve vodě a v ethanolu (ve vroucím však ano), snadno rozpustná v chloroformu, etheru, silicích a v mastných olejích. Teplota tání je 43–52 °C. Používala se k přípravě změkčujících oleomastí a oleokrémů. Dnes je již nahrazena cetyl-palmitátem – *Cetylis palmitas* ČL 2009.