



جامعة إيبلا الخاصة

كلية الصيدلة



د. سامر قبّاع

عدد الصفحات (7)

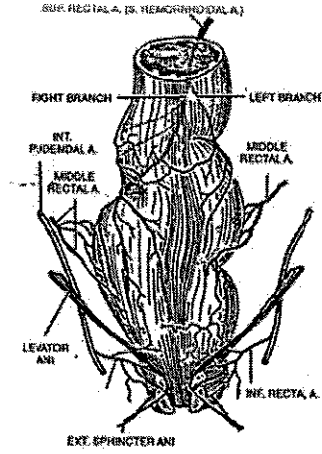
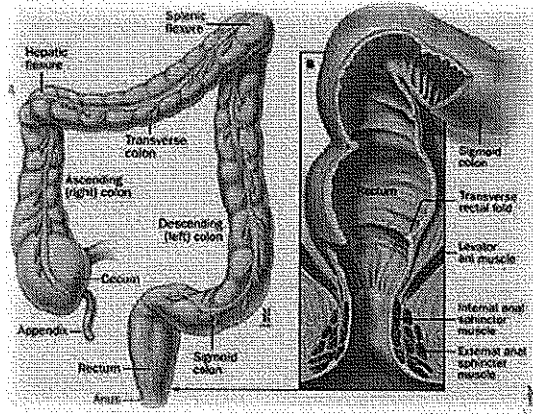
ص

• التحاميل:

هي مستحضرات ذات قوام صلب سهلة الانصهار أو منحلة في الماء ذات شكل مخروطي الجذع أو بيضوي مخصصة للإدخال في المستقيم. يسمح شكل التحميلة بإمساك جيد للدواء داخل المستقيم و يمنع لفظها من قبل المعصرة الشرجية.

• وزن التحاميل:

- ✓ تحاميل الأطفال 1 غ
- ✓ تحاميل الكبار حوالي 2.5 غ.
- امتصاص الأدوية عبر المستقيم :



البنية التشريحية للمستقيم

المستقيم يقسم إلى ثلاث مناطق سفلى – وسطى – عليا حيث أن:

- المنطقة السفلى والوسطى تنبتق منها الأوردة الباسورية السفلى والوسطى والتي تصب في الأوردة الحرقفية ومنها إلى الوريد الأجوف السفلي في القلب أي أن المادة الدوائية تدخل مباشرة إلى الدوران دون المرور عبر الكبد.
- المنطقة العليا ينبتق منها الأوردة الباسورية العليا التي تصب في الوريد البابي في الكبد , وبالتالي من أجل تجنب المرور الكبدي وزيادة التوافر الحيوي يجب توجيه الامتصاص نحو الأقسام السفلية من المستقيم.

• ميزات التحاميل:

1. تجنب التأثير المخرب للخمائر الهضمية لبعض المواد الدوائية الحساسة.
2. تقديم مقادير كبيرة من المواد الدوائية ذات التأثير المخرش للغشاء المخاطي المعدي.
3. تقديم مواد دوائية ذات طعم ورائحة كريهتان غير ممكنة التقديم عبر الفم.
4. بعض المرضى غير قادرين على ابتلاع الأدوية فمويًا اما لمشاكل في القناة الهضمية أو لغياب الوعي أو بعد العمليات الجراحية أو بعض الأعمار مثل الرضع.
5. يمكن اعطاء أشكال صيدلية كبيرة الحجم نسبيًا.
6. ان طريق المستقيم امن و مناسب لكبار السن و الشباب و لا يسبب الألم.
7. ان تمديد الدواء محدود بسبب صغر حجم السائل الموجود ضمن المستقيم.
8. المستقيم يكون عادة فارغًا.
9. يتم تجنب تخرب و اطراح الدواء عن طريق المرور الكبدي الأول بشكل جزئي.
10. يمكن التحكم بمدة التأثير عن طريق اختيار السواغ المناسب.
11. يعتبر المستقيم بيئة ذات شروط ثابتة.
12. تجنب فرط الجرعة.

• مساوئ التحاميل:

1. عدم تقبل المرضى و اشمئزازهم منها و خصوصًا بالنسبة للمعالجات طويلة الأمد.
2. ان حركة التحاميل للأعلى يمكن أن تزيد الاستقلاب عن طريق المرور الكبدي الأول.
3. يمكن للتحاميل ان تخرج بعد ادخالها.
4. بشكل عام ان امتصاص الدواء من التحاميل يكون بطيئًا مقارنة مع الطريق الفموي أو الوريدي (قلة حجم السوائل و صغر مساحة السطح المتوفر للامتصاص).

• العوامل المؤثرة في الفعالية العلاجية للتحاميل:

1. العوامل الفيزيولوجية
2. كمية السائل المتوفر في المستقيم.
3. حالة غشاء المستقيم.
4. درجة حموضة مخاطية المستقيم.

بهاء (3.6-4)	بهاء (6.8-7)	
42%	12%	حمض الصفصاف
32%	44%	أنيلين

• الخصائص الفيزيوكيميائية للمادة الفعالة

لكي يكون الدواء جاهزا للامتصاص يجب ان يتحرر من التحميلة و أن يتوزع في السوائل المحيطة بالتحميلة و
بأنحلاله في السوائل يحصل تماس كبير للدواء مع أغشية المستقيم مما يزيد من امتصاصه.
ان انتقال المادة الدوائية بدءا من طبقة السواغ المصهور أو المنحل و المغلفة للغشاء المخاطي لا يتبع فقط
لخصائص طبقة السواغ و لكن يتبع أيضا للخصائص الفيزيوكيميائية للمادة الفعالة و أهمها:

1. انحلالية المادة الفعالة.
2. عامل توزع المادة الفعالة بين السواغ الدسم و سائل المستقيم.
3. بعد أجزاء المادة الفعالة.
4. تركيز المادة الفعالة في سائل المستقيم.

• خصائص السواغات المؤثرة في الفعالية العلاجية للتحاميل:

1. تأثير قدرة السواغ الحالة للمادة الفعالة.
2. تأثير مواصفات انصهار السواغات.
3. تأثير قرينة هيدروكسيل السواغات.
4. تأثير العوامل الفعالة سطحيا.

• قرينة الهيدروكسيل:

هي عدد ميلغرامات هيدروكسيد البوتاسيوم اللازمة لتعديل حمض الخل المتحد في شروط محددة ب 1 غ سواغ.

Optimizing Drug Absorption

A- Enhancing agents.

B- pH control.

C- Solubilizing agents.

D- Viscosity modifiers.

• المعايير الوصفية لسواغات التحاميل:

1. أن ينصهر السواغ في درجة حرارة الجسم و أن ينحل أو يتبعثر في مفرزات المستقيم.
2. أن يكون خاملا فيزيولوجيا الا اذا كان مخصصا لتحضير التحاميل المليئة.
3. خالي السمية لا يخرش المستقيم ناعم الملمس.
4. يحافظ على قوامه في درجات حرارة حفظه الاعتيادية
5. يبقى ثابتا طوال مدة حفظه.
6. يبقى ثابتا لدى تسخينه لدرجة حرارة أعلى من درجة حرارة انصهاره.

7. قابل للتقلب.
8. يتوافق مع المواد الدوائية المضافة اليه.
9. يؤمن توزيعا متجانسا لكمية المادة الدوائية الموصوفة.
10. قادر في بعض الحالات على امتصاص المحاليل المائية للمواد الدوائية.
11. في حال تحاميل ذات تأثير علاجي عام على السواغ أن يحرر سريعا المادة الفعالة و بشكل تام لضمان الامتصاص الجيد للمادة الدوائية.
12. في حال تحاميل ذات تأثير علاجي موضعي على السواغ أن يحرر الدواء ببطء.

• المعايير التقنية لسواغات التحاميل

- 1- نقطة التصلب (تعدد الشكل، ادخال مواد مختلفة).
- 2- اللزوجة و خصائص الانسياب (عدم تجانس المحتوى، ترسب المواد في أسفل القالب).
- 3- قابلية التأكسد. (قرينة اليود: هي مقدار اليود مقدرا بالغرام التي تثبته 100 غ من المادة الدسمة).
- 4- القدرة على امتصاص الماء.
- 5- القدرة على التقلص: حمض الغار.
- 6- القوام.
- 7- المظهر الخارجي (التزهر: هجرة بعض البلورات غير الثابتة إلى السطح، المظهر الدبق: وجود كميات كبيرة من استرات لحموض دسمة منخفضة الوزن الجزيئي)

• سواغات التحاميل

تصنف الى:

1. السواغات الدسمة: تتضمن غليسيريدات لحموض دسمة مشبعة أو غير مشبعة و الزيوت المهدرجة، و مزيج من أجسام دسمة نصف صناعية تتضمن أحادية الغليسيريدات و ثنائيتها و ثلاثيتها لحموض دسمة مشبعة (سواغات نصف صناعية)
2. السواغات المنحلة في الماء: كامزجة الجيلاتين و الغليسيرين و الماء و البولي إيثيلين غليكول و مشتقات البولي أوكسي إيثيلين .

و تقسم السواغات الدسمة وفق حبها للماء الى زميرتين:

1. سواغات دسمة كارهة للماء: كليا غير منحلة فيه مثل زبدة الكاكاو.
2. سواغات دسمة محبة للماء: (سواغات استحلابية): زبدة الكاكاو المضاف اليها اللانولين، أو مزيج من غليسيريدات لحموض دسمة ذات قرينة هيدروكسيل مرتفعة.

❖ زبدة الكاكاو

تستخلص بالعصر على الساخن للبذور المحمصة لنبات الكاكاو وتوجد زبدة الكاكاو بشكل كتل بيضاء مصفرة لها رائحة الكاكاو وطعمه .

تتكون زبدة الكاكاو من ثلاثيات الغليسيريدات لحموض دسمة غير مشبعة و مشبعة.

- ميزاتها:

- ✓ مواصفات انصهارها المثالية القادرة على تحرير المواد الدوائية داخل المستقيم.
- ✓ سهولة كسرها في درجات الحرارة المنخفضة مما يجعلها سهلة البشر تمهيدا لتحضير تحاميلها بطريقة الضغط على البارد

- مساوئ زبدة الكاكاو

- ✓ ظاهرة تعدد الشكل.
- ✓ ضعف القدرة على امتصاص الماء-
- ✓ ميل ضعيف نحو التقلص.
- ✓ فاصل انصهار كبير جدا مما يؤدي الى ترسب المواد الفعالة العالقة فيها في حالتها المصهورة.
- ✓ عدم الثباتية الكيميائية.
- ✓ السعر المرتفع.

❖ السواغات المنحلة في الماء

تصنف السواغات المنحلة في الماء الى زمرتين أساسيتين:

- ✓ زمرة الهلاميات العضوية المائية.
- ✓ زمرة البولي اتيلين غليكول.

Solubility in		
Fat	Water	Choice of base
Low	High	Fatty base
High	Low	Aqueous base

❖ تحاميل الجيلاتين مع الغليسرين

جيلاتين 13

ماء 22

غليسرين 65

✓ تبدي هذه التحاميل مساوي عديدة أهمها:

1. تتمتع هذه التحاميل بفعالية خاصة ناجمة عن وجود الغليسرين الملين.
2. تعد هذه التحاميل سينة الحفظ باعتبارها وسطا نموذجيا لنمو الجراثيم و الفطور.
3. يمكن أن تسبب هذه السواغات تناقرات عديدة مع المواد الدوائية بسبب وجود الجيلاتين (العقص، أملاح المعادن الثقيلة)، و بسبب وجود الغليسرين (تجميع الوسط بوجود البوراكس و تثبيط فعالية البنسلين)

❖ سواغات البولي إيثيلين غليكول:

متماثرات لأوكسيد الإيثيلين، سائلة في الأوزان الجزيئية 200-600 و صلبة في الأوزان الجزيئية الأعلى من 1000.

✓ مساوئها:

1. انحلالها البطيء في سوائل المستقيم.
2. تأثيرها المخرش لغشاء المستقيم.
3. تناقراتها مع عدد من المواد الدوائية: كالهالوجينات و الفينولات و بعض المضادات الحيوية.
4. أمزجتها مع السلفاميدات تصفر مع الزمن.

Rate of drug release from different suppository bases

Drug vs. base characteristics	Approximate drug release rate from dosage form
Oil-soluble drug with oily base	Slow release –poor escaping tendency
Water-soluble drug with oily base	Rapid release
Oil-soluble drug with water miscible base	Moderate release rate
Water-miscible drug with water miscible base	Moderate release