





ФОРМИ







ВАГІНАЛЬНИХ ЗАСОБІВ

Вагінальна слизова є унікальною фармакокінетичною системою, яка поєднує високу проникність, активний місцевий імунітет, власний мікробіом та виражену гормональну чутливість. Саме тому ефективність локальної терапії залежить не лише від діючої речовини, а й від того, у якій фармацевтичній формі вона доставляється.

Вагінальне застосування дозволяє:

-  створювати високу локальну концентрацію препарату
-  мінімізувати системне навантаження
-  уникати ефекту “першого проходження” через печінку
-  забезпечувати пролонгований контакт речовини зі слизовою оболонкою

Однак різні лікарські форми взаємодіють зі слизовою принципово по-різному. На це впливають:

-  тип основи
-  ступінь гідрофільності або ліпофільності
-  швидкість розчинення
-  адгезія до слизової
-  здатність утримувати вологу
-  вплив на рН та вагінальний мікробіом



Саме тому одна й та сама активна речовина у формі крему, супозиторія або вагінальної таблетки може демонструвати різний профіль дії, переносимості та швидкості клінічного ефекту.

ВАГІНАЛЬНІ СУПОЗИТОРІЇ



Вагінальні супозиторії — це тверді дозовані лікарські форми, які плавляться або розчиняються при температурі тіла чи під дією вагінального секрету. Вони залишаються однією з найпоширеніших локальних форм у гінекології завдяки здатності забезпечувати тривалий контакт препарату зі слизовою оболонкою.

Основу супозиторіїв можуть становити:

- ліпофільні жирові компоненти
- напівсинтетичні гліцериди
- поліетиленгліколі
- гідрофільні полімери

МЕХАНІЗМ ВЗАЄМОДІЇ ЗІ СЛИЗОВОЮ

Після введення супозиторій поступово стає рідким або розчиняється, формуючи локальне депо активної речовини. Це дозволяє підтримувати високу концентрацію препарату без значного системного всмоктування.

Ліпофільні основи

- довше утримуються на слизовій
- створюють оклюзивний ефект
- зменшують трансепітеліальну втрату вологи

Гідрофільні основи

- швидше вивільняють речовину
- краще взаємодіють із вагінальним секретом
- можуть забезпечувати більш прогнозовану абсорбцію



КЛІНІЧНІ ОСОБЛИВОСТІ

Супозиторії особливо ефективні при локальних інфекційних процесах, комбінованій антимікробній терапії, станах, що потребують тривалого контакту препарату зі слизовою.

Водночас надлишок жирової основи може викликати витікання, змінювати відчуття комфорту, впливати на рівномірність розподілу активної речовини.







! Перед використанням вагінальних свічок важливо дотримуватись гігієни рук, уникати агресивних засобів інтимної гігієни, якщо супозиторій має м'яку жирову основу й швидко тоне в руках, його можна помістити в холодильник на 5–10 хвилин перед введенням — це полегшить використання та допоможе зберегти форму препарату.

ВАГІНАЛЬНІ КРЕМИ

Креми є емульсійними системами типу “олія у воді” або “вода в олії”, що забезпечують більш фізіологічний контакт зі слизовою оболонкою. На відміну від супозиторіїв, крем не формує щільного депо, а створює рівномірний тонкий шар активної речовини на поверхні епітелію.

КРЕМОВА ФОРМА:

-  швидко розподіляється
-  забезпечує велику площу контакту
-  зменшує механічне подразнення
-  підтримує гідратацію слизової

Емульсійна структура дозволяє одночасно:

- Доставляти ліпофільні компоненти
- Зменшувати відчуття сухості та печіння
- Підтримувати вологість тканин



Завдяки тонкому розподіленню креми можуть забезпечувати швидший початок дії, активне поверхнєве всмоктування, часткову системну абсорбцію.

Особливо це стосується гормональних кремів, де ступінь проникнення залежить від:

- товщини епітелію
- рівня естрогенів
- стану кровопостачання слизової



Для комфортнішого введення аплікатор можна трохи зігріти в руках, а після застосування бажано уникати активних фізичних навантажень, оскільки кремові форми рівномірно розподіляються по слизовій і можуть частково витікати в перші хвилини після нанесення.

МАЗІ

Мазі мають переважно ліпофільну основу та містять мінімальну кількість води. Через високу жирність вони рідше застосовуються інтравагінально, однак можуть бути корисними при вираженому подразненні або пошкодженні слизової.

ВЗАЄМОДІЯ ЗІ СЛИЗОВОЮ

- ✓ формує щільний захисний шар
- ✓ зменшує випаровування вологи
- ✓ довше утримує діючу речовину
- ✓ захищає епітелій від механічного подразнення

Однак висока оклюзивність може погіршувати комфорт, змінювати аерацію слизової, впливати на природний баланс мікробіому.

КЛІНІЧНЕ ЗНАЧЕННЯ

- ✓ при мікропошкодженнях слизової
- ✓ вираженій сухості
- ✓ зовнішньому подразненні
- ✓ після агресивної локальної терапії

ВАГІНАЛЬНІ ГЕЛІ

Гелі є однією з найбільш технологічних локальних форм завдяки здатності адгезувати до слизової оболонки.

Біоадгезивні полімери:

- ✓ утримують препарат на поверхні епітелію
- ✓ пролонгують контакт
- ✓ контролюють швидкість вивільнення

ВПЛИВ НА МІКРОСЕРЕДОВИЩЕ

Гелі активно взаємодіють із вагінальним середовищем:

- ✓ підтримують фізіологічний рН
- ✓ зменшують сухість
- ✓ можуть впливати на біоплівки мікроорганізмів

Деякі гелі створюють захисну гідрофільну матрицю, яка зменшує подразнення, підтримує регенерацію, покращує комфорт терапії.

ВАГІНАЛЬНІ ТАБЛЕТКИ

Вагінальні таблетки – це пресовані тверді форми з високою стабільністю та точним дозуванням. На відміну від супозиторіїв, вони не плавляться, а поступово дезінтегрують під впливом вагінального секрету.

ОСОБЛИВОСТІ АБСОРБЦІЇ

Для повноцінного розчинення таблетці необхідна достатня кількість вологи. Тому ефективність цієї форми може знижуватись у постменопаузі, при атрофії слизової, вираженій сухості.

ВЗАЄМОДІЯ ЗІ СЛИЗОВОЮ

Після дезінтеграції активна речовина поступово проникає в слизову, створює локальну концентрацію та взаємодіє з вагінальним секретом.

Швидкість вивільнення залежить від пористості таблетки, типу допоміжних речовин, рівня гідратації слизової.

ВАГІНАЛЬНІ КАПСУЛИ

Вагінальні капсули поєднують переваги твердих і м'яких форм. Желатинова оболонка швидко розчиняється після контакту зі слизовою, вивільняючи рідкий або напіврідкий вміст.

- ✓ Забезпечують швидке вивільнення
- ✓ Менше подразнюють слизову
- ✓ Комфортні у введенні
- ✓ Дозволяють інкапсулювати нестабільні компоненти

Особливо ефективними вони є для ліпофільних речовин, олійних екстрактів, пробіотичних комплексів, комбінованих формул.



ВЗАЄМОДІЯ ЗІ СЛИЗОВОЮ

Рідкий вміст капсули швидко покриває епітелій, забезпечує рівномірний розподіл, покращує контакт діючої речовини з поверхнею слизової.

ВАГІНАЛЬНІ КІЛЬЦЯ

Вагінальні кільця – це полімерні системи контрольованого вивільнення, які забезпечують стабільну подачу активної речовини протягом тижнів або місяців.

Після введення активна речовина:

- дифундує через полімерну матрицю
- поступово вивільняється
- підтримує стабільну локальну концентрацію

✓ Мінімізують коливання концентрації

✓ Зменшують залежність від комплаєнсу

✓ Мають контрольоване вивільнення

ФАКТОРИ, ЯКІ ВИЗНАЧАЮТЬ ЕФЕКТИВНІСТЬ ФОРМИ

1. рН вагінального середовища

Залежить стабільність діючої речовини, активність мікрофлори, ступінь іонізації компонентів.



2. Рівень естрогенів

Естрогени впливають на товщину епітелію, гідратацію, кровопостачання, швидкість регенерації слизової.

3. Стан мікробіому

Нормальна лактофлора підтримує кисле середовище, зменшує адгезію патогенів, впливає на локальний імунітет.



4. Тип основи препарату

Визначає швидкість вивільнення, ступінь проникнення, комфорт використання, тривалість контакту зі слизовою.

У локальній вагінальній терапії лікарська форма є не просто “носієм” активної речовини. Вона виступає окремим фармацевтичним механізмом, який визначає швидкість вивільнення, глибину проникнення, взаємодію зі слизовою оболонкою та комфорт лікування.

! Підхід до вагінальної терапії передбачає оцінку не лише молекули, а й усієї фармацевтичної архітектури засобу – від типу основи до її біoadгезивних властивостей і впливу на мікросередовище слизової.