

Hva gjør hjelpestoffene?

Hvorfor kan man ikke bare gi medisinen som rent virkestoff, og slippe disse bekymringene rundt hjelpestoffene? Hjelpestoffene har en viktig rolle i å hjelpe virkestoffet til å gjøre sin ønskede virkning i kroppen. Hver type medisin (legemiddelform) har sine behov for hjelpestoffer: I tabletter er det noen klasser hjelpestoffer som ofte er med, i salver er det andre hjelpestoffer og i injeksjonspreparater er det igjen andre klasser hjelpestoffer som er vanlige. Ingen hjelpestoffer tilsettes uten at det har en egen funksjon. Nedenfor er det angitt typiske hjelpestoffer for de vanligste legemiddelformene, med en kort forklaring på hvilken funksjon de har:

Generelle funksjoner, som er nyttige i mange legemiddelformer:

- **Konserveringsmiddel:** Bidrar til at det ikke blir oppblomstring av mikrober (sopp, bakterier) i medisinen under lagring, og særlig etter at medisinen er åpnet første gang. I tillegg til at ukontrollert vekst av mikrober kan være skadelig for pasienten kan disse også ødelegge virkestoffet slik at den medisinske virkningen blir mindre eller uteblir helt.
- **Antioksidant:** Motvirker at virkestoffet eller hjelpestoffer blir oksidert, det vil si ødelagt når de kommer i kontakt med oksygen (luft).
- **Andre stabilisatorer** som bidrar til at virkestoffet ikke blir kjemisk forandret eller inaktivert fysisk. Eksempel på fysisk inaktivering kan være at et oppløst virkestoff i en mikstur samler seg som bunnfall i flasken.

Hjelpestoff i tabletter og kapsler

Eksemplene er beskrevet for tabletter, men mange av disse gjelder også for kapsler

Fyllstoff: Noen ganger er dosen så lav (noen få milligram eller mikrogram) at tablett må gjøres større for at den skal være mulig å få tak i. En vanlig tablett veier ofte mellom 100 og 500 mg totalt, men det finnes både mindre og større tabletter enn dette.

Oppløsningsfremmende stoff: For at kroppen skal kunne ta opp (absorbere) medisinen i magen og tarmen må det være oppløst, og ikke foreligge som pulver. Noen virkestoffer er dårlig løselige, og hjelpestoffene bidrar til at virkestoffet blir oppløst raskt nok slik at det kan tas opp i kroppen som forutsatt.

Stoffer som endrer normal oppløsningshastighet: Noen tabletter gir den beste medisinske effekten hvis virkestoffet løses opp sakte over flere timer, eller hvis det løses opp ett bestemt sted i mage-tarmsystemet. Disse medisinene kalles gjerne depottabletter, enterotabletter eller tabletter med modifisert frisetting. Hjelpestoffer kan gi en slik forsinket eller forlenget effekt.

Stoffer som er nødvendige for produksjonen av tablettene: Tabletter lages ved å komprimere pulver i en tablettmaskin, og prosessen foregår svært raskt. Pulveret må renne fritt uten å klumpe seg. Det er dessuten viktig at pulverblandingen alltid er jevn, slik at alle tabletter inneholder de samme stoffene i riktig mengde. Når pulveret komprimeres til tabletter er det også viktig at de ikke setter seg fast i tablettmaskinen. En rekke hjelpestoffer bidrar til å unngå disse problemene.

Smaksmaskering, smaksstoff: Mange virkestoffer smaker bittert og derfor tilsettes det stoffer som maskerer denne smaken eller det tilsettes egne stoffer med god smak som konkurrerer ut den vonde virkestoffsmaken.

Drasjering: Mange tabletter får et tynt lag utenpå som gir tablett en jevn og glatt overflate eller en bestemt farge. Dette laget kalles gjerne drasjélag eller coating. Ofte har dette ingen direkte medisinsk effekt, men en glatt tablett kan være lettere å svelge, og farger kan bidra til å skille mellom ulike medisiner. I noen tabletter vil drasjélaget påvirke oppløsningshastigheten. Se avsnittet om stoffer som endrer normal oppløsningshastighet.

Hjelpestoff i miksturer

I miksturer er det viktig om virkestoffet er oppløst i væsken, såkalt oppløsning, eller om det foreligger som uløste partikler, såkalt suspensjon. I en oppløsning kan man være sikker på at sammensetningen av miksturen er lik hver gang man tar en ny dose av medisinen, mens i en suspensjon vil partiklene synke til bunns eller flyte opp. Derfor må miksturen ristes rett før man tar ut dosen slik at det blir en jevn blanding. Det er først da man får riktig dose, og riktig sammensetning av medisinen.

Oppløsningsfremmende stoff: Når virkestoffet er dårlig løselig kan det være aktuelt med hjelpestoffer som øker løseligheten. Det er hovedsakelig to hovedtyper hjelpestoffer som bidrar til dette: løsemidler og overflateaktive stoffer (surfaktanter, "såpe-lignende" stoffer). Virkestoffet kan være bedre løselig i andre løsemidler enn vann, og ofte er det nok å ha litt av andre løsemidler i vannblandingen for at virkestoffet løser seg. Overflateaktive stoffer

virker ved å nærmest kapsle inn et dårlig løselig virkestoff og dermed gjøre det blandbart med vann. Dette er etter samme prinsipp som når såpe kapsler inn fett slik at det blir lettere å skylle vekk skitt.

Stabilisatorer: Når miksturen er en suspensjon er det viktig at partiklene ikke klumper seg sammen for å sikre en jevn blanding av både virkestoff og hjelpestoffer. Stabilisatorer bidrar til at suspensjonen er lett å riste opp etter at den har stått lagret. Dette bidrar til at hver dose har samme innhold.

Konserveringsmiddel: Dette er særlig aktuelt for miksturer, som består av mye vann og ofte andre bestanddeler som fremmer bakterie- og soppvekst (bl.a. ulike typer sukker)

Antioksidant: Dette er særlig aktuelt for miksturer, der virkestoffet er oppløst. Kjemiske reaksjoner går mye raskere i løsning/vandig miljø enn i pulver. Dessuten bidrar ofte lys som hastighetsøkende faktor i slike kjemiske reaksjoner, og siden miksturen er gjennomsiktig utsettes hele miksturen for lys.

Smaksmaskering, lukt- og smaksstoff: Problemet med vond smak av virkestoffer er ekstra aktuelt for miksturer, siden stoffer som er oppløst smaker sterkere enn for eksempel pulver som ikke løser seg i munnen.