

CELULOSIX

EXCIPIENTES  PADRONIZADOS



Os excipientes são compostos de uso farmacêutico que devem apresentar caráter inerte quanto a interação com outros ingredientes, eles cumprem as funções de diluir, preencher e dissolver, além de conferir peso e volume ao medicamento. É importante salientar que a qualidade dos medicamentos depende não somente dos ativos e dos processos de manipulação, mas também do desempenho dos excipientes, especialmente no que tange o processo de reprodutibilidade das formulações, ou seja, garantir que os efeitos sejam sempre os mesmos.

Selecionar o excipiente mais adequado ao fármaco a ser encapsulado em função de sua solubilidade em meio aquoso e permeabilidade intestinal, respeitando-se ainda parâmetros como higroscopicidade, incompatibilidade, estabilidade e propriedades de fluxo são de extrema importância não apenas farmacotécnica, mas farmacológica em sua efetividade.

LINHA CELULOSIX®

Os excipientes Celulosix® são a base de celulose microcristalina, desenvolvida tecnologicamente para cápsulas. Não causa nenhum tipo de interação, o que torna o excipiente ideal para atender os preceitos de efetividade. A ausência de lactose na composição dos excipientes Celulosix® contribui para pacientes intolerantes a esse açúcar.

Possuem validade adequada, otimiza a padronização de formulações, além da versatilidade de uso.

Vantagens

- ✓ Preservam a estabilidade dos ativos;
- ✓ Proporcionam precisão de dose, por facilitar a distribuição de partículas
- ✓ Modulam a solubilidade e a biodisponibilidade dos ativos, através da desagregação e dissolução;
- ✓ Fluidez (Flow);
- ✓ Reduz tempo de processo;
- ✓ Inertes fisiologicamente;
- ✓ Atendem a legislação sanitária vigente e a classificação biofarmacêutica;
- ✓ Reprodutibilidade lote a lote;
- ✓ Ausência de alergênicos (lactose, glúten, soja, entre outros);
- ✓ Apresentam estudos laboratoriais;

Composição

EXCIPIENTES	COMPOSIÇÃO	INDICAÇÃO DE USO	FUNÇÃO	EXEMPLOS
CELULOSIX® Solúveis	Aerosil®, Amido pré-gelatinizado e Celulose Microcristalina	Ativos de alta solubilidade Classes I e III	Promover a desintegração sem interferir na dissolução	Amitriptilina, Atenolol, Captopril, Diltiazem, Metronidazol Prometazina, Reserpina
CELULOSIX® E (Insolúveis)	Ácido esteárico, Croscarmelose sódica, Lauril sulfato de sódio, Aerosil® e Celulose Microcristalina	Ativos de baixa solubilidade Classes II e IV	Promover a dissolução do ativo	Carbamazepina, Haloperidol, Ibuprofeno, Espironolactona, Sulfadiazina
CELULOSIX® Higroscópicos	Aerosil®, Estearato de magnésio, Silicato de magnésio e Celulose Microcristalina	Ativos higroscópicos	Oferecer maior resistência à umidade	L-Carnitina, Cianocobalamina, Tetraciclina, Hipericum perforatum, Tribulus terrestris
CELULOSIX® Liberação Modificada	Aerosil®, Carbopol®, Estearato de magnésio, Methocel® e Celulose Microcristalina	Ativos de liberação modificada	Promover alteração na velocidade de desintegração	Ácido nicotínico, Atenolol, Diclofenaco sódico, Glimepirida, Lisinopril, Memantina, Pentoxifilina, Ticlopidin

Recomendação de Uso

No caso de serem adotados os CELULOSIX E® (Insolúveis) e para os solúveis a farmácia pode adotar excipiente “qsp” contanto que o excipiente seja pelo menos a mesma dose do(s) ativo(s) da formulação;

Para o CELULOSIX® Higroscópico a proporção deve ser de 1 parte de ativo para 1 parte do CELULOSIX®.

Já o CELULOSIX® Liberação Modificada pode ser adotado como excipiente “qsp” contanto que pelo menos 50% do volume da cápsula seja preenchido pelo excipiente. Manipular somente em cápsulas de tamanho igual ou maior que a cápsula 1.

Estudos Laboratoriais

Os excipientes Celulosix® foram avaliados laboratorialmente, para atestar a qualidade dos excipientes frente as principais necessidades farmacotécnicas nas farmácias. Ensaios realizados pelo laboratório Proquimo Improvement.

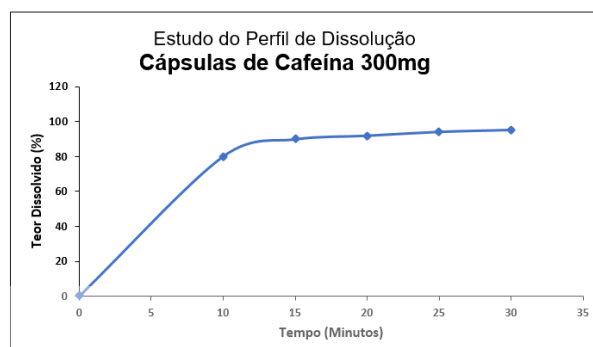
CELULOSIX® Solúveis

Foram realizados testes de dissolução baseados na farmacopeia, para avaliar se o perfil do fármaco era mantido por determinado período de tempo, observando assim a eficácia do excipiente.

1 – Cafeína 300mg

Excipientes: CELULOSIX solúveis.

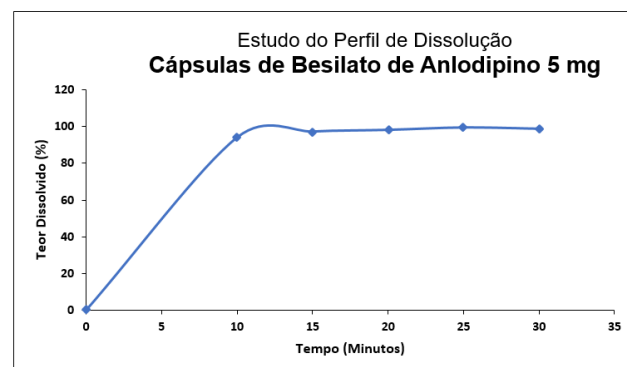
Análise Físico Química – Resultados em %					
Cápsula	10 MIN	15 MIN	20MIN	25 MIN	30 MIN
1	79,3	86,9	88,2	90,4	92,8
2	86,0	91,8	91,6	92,0	93,9
3	92,9	97,9	97,2	98,5	97,4
4	78,8	97,6	99,8	100,3	100,0
5	73,4	84,6	90,2	93,8	94,4
6	69,9	80,0	84,6	89,6	92,5
Média	80,0	89,8	91,9	94,1	95,2



2 – Besilato de Anlodipino – 5mg

Excipientes: CELULOSIX solúveis.

Análise Físico Química – Resultados em %					
Cápsula	10 MIN	15 MIN	20MIN	25 MIN	30 MIN
1	93,8	96,6	97,4	98,4	98,2
2	93,2	96,3	97,0	97,3	98,4
3	92,6	95,5	97,2	97,2	98,4
4	94,2	97,7	98,3	102,3	99,1
5	95,6	98,9	99,9	101,3	99,3
6	95,3	99,0	99,4	100,6	99,6
Média	94,1	97,3	98,2	99,5	98,8



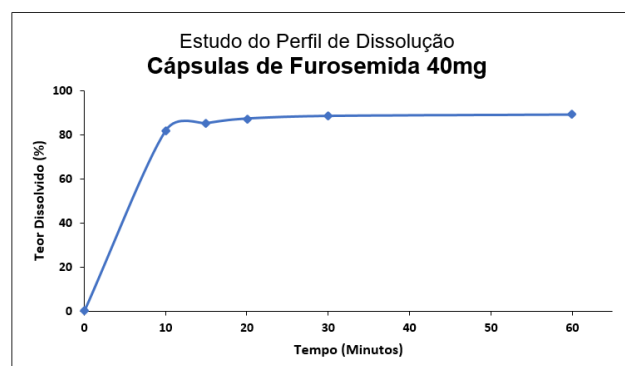
O CELULOSIX E® (Insolúveis)

Foram realizados testes de dissolução baseados na farmacopeia para avaliar se o perfil do fármaco era mantido por determinado período de tempo, além da correta solubilidade garantindo assim, que o medicamento possa ser absorvido, garantindo a eficácia do excipiente.

1 - Furosemida 40mg

Excipientes: CELULOSIX (insolúveis).

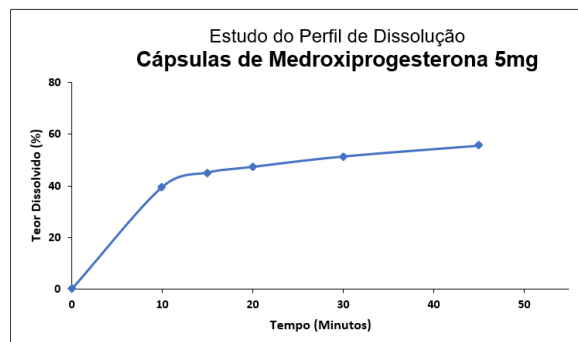
Análise Físico Química – Resultados em %					
Cápsula	10 MIN	15 MIN	20MIN	30 MIN	60 MIN
1	79,4	83,6	85,8	86,0	87,5
2	75,7	79,3	81,0	83,5	86,8
3	87,1	90,4	94,2	96,5	92,5
4	84,8	85,9	87,0	87,9	88,4
5	88,9	90,5	91,4	91,3	92,6
6	76,0	82,9	85,8	86,9	88,0
Média	82,0	85,4	87,5	88,7	89,3



2 – Medroxiprogesterona 5mg

Excipientes: CELULOSIX (insolúveis).

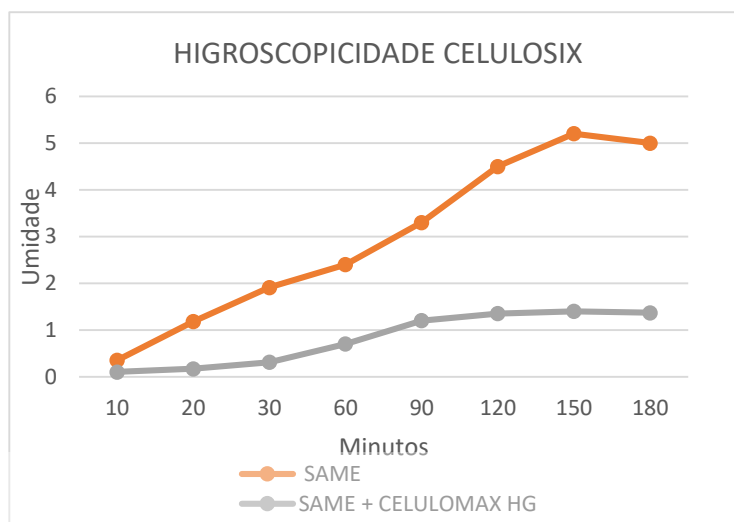
Análise Físico Química – Resultados em %					
Cápsula	10 MIN	15 MIN	20MIN	30 MIN	45 MIN
1	38,6	43,6	45,5	49,1	52,7
2	47,4	54,3	56,1	60,1	64,3
3	34,2	40,0	44,8	48,0	55,3
4	33,6	38,3	41,1	48,3	53,2
5	39,3	43,4	45,0	47,3	50,3
6	44,4	51,7	52,1	55,7	58,2
Média	39,6	45,2	47,4	51,4	55,6



Os resultados obtidos permitiram concluir que o potencial de aplicação do CELULOSIX® E (Insolúveis) como excipiente para cápsulas contendo fármacos Insolúveis. Os ensaios de dissolução resultaram em taxas que atenderam às especificações farmacopeicas para os medicamentos avaliados. Adicionalmente, os parâmetros de peso médio e uniformidade de doses unitárias conformes podem ter sido favorecidos pela boa propriedade de fluxo do excipiente, que influencia no preenchimento uniforme de cápsulas.

CELULOSIX® - Higroscópicos

O **CELULOSIX®** para insumos **higroscópicos** foi avaliado em relação a sua influência na captação de umidade ambiental quando misturado a um insumo higroscópico como o S.A.M.E. Os resultados permitiram observar uma significativa redução da captação de umidade pela mistura de CELULOSIX® e S.A.M.E.



O potencial de aplicação do CELULOSIX® como excipiente para ingredientes farmacêuticos ativos e deliquescentes também foi evidenciada com a observação da estabilidade física de cápsulas duras demonstradas nas imagens a seguir:



a) L Carnitina + Lactose monohidratada



b) L-Carnitina + CELULOSIX Higroscópicos a 50% 25°C / 2 meses

A composição do **CELULOSIX® Higroscópico** confere uma baixa captação de umidade aliada a uma ação absorvente, boas características de fluxo e compatibilidade, reduzindo problemas relacionados à higroscopia e deliquescência, sem impacto negativo na desintegração e dissolução.

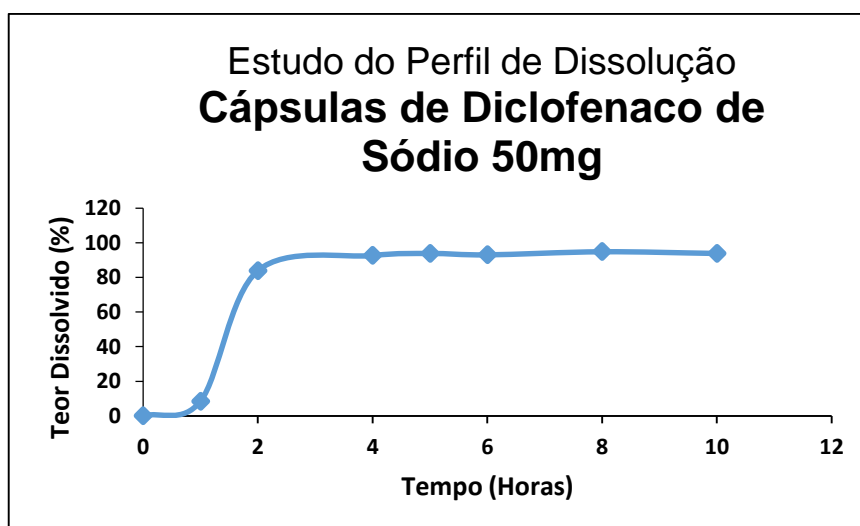
CELULOSIX® Liberação Modificada

CELULOSIX® Liberação Modificada ao ser ingerido ou em contato com o meio de dissolução forma matriz hidrofílica que promove uma alteração na velocidade de desintegração da cápsula, promovendo uma lenta liberação de seu conteúdo. É recomendado para ingredientes farmacêuticos ativos de meia vida curta, minimizando efeitos adversos associados aos altos picos de concentração plasmática, e reduzindo a necessidade de administração de diversas doses.



Ensaio Perfil de Dissolução
Cápsulas de Diclofenaco de Sódio 50mg

Análise Físico Química – Resultados em %							
CAPS.	1 Hs	2 Hs	4 Hs	5 Hs	6 Hs	8 Hs	10 Hs
1	7,5	85,8	91,1	92,6	92,2	94,3	94,5
2	9,1	82,5	93,0	93,5	92,0	95,3	94,4
3	11,1	83,2	92,9	96,6	93,4	97,8	91,9
4	6,7	84,0	93,9	94,0	93,5	94,7	94,2
5	9,8	83,3	93,1	94,0	93,4	94,1	94,1
6	6,3	84,3	92,4	93,0	93,9	93,4	94,3
Média	8,4	83,8	92,7	93,9	93,1	94,9	93,9



Referências Bibliográficas

1. AGÊNCIA NACIONAL DE VIGILÂNCIA SANITÁRIA. **RDC nº 67, de 8 de outubro de 2007. Legislação. Visalegis. Determina o** Regulamento Técnico sobre Boas Práticas de Manipulação de Preparações Magistrais e Oficiais para Uso Humano em farmácias e seus Anexos. Disponível em http://www.anvisa.gov.br/legis/resol/2007/rdc/67_081007rdc.htm. Acesso em 18 de abril de 2012.
2. DORLAND'S ILLUSTRATED MEDICAL DICTIONARY, 25th Ed, 1974.
3. FERREIRA, A.O. Guia prático da farmácia Magistral, volume 1. 4ª. ed. São Paulo: Pharmabooks, 2008. p. 43-146.
4. <http://166.78.14.201/tsrlinc.com/services/bcs/index.htm>