

Вспомогательные ингредиенты на помощь активным субстанциям



Компания Merck с радостью делится своим обширным опытом и глубокими знаниями в области применения различных инновационных разработок для повышения растворимости и модификации кинетики высвобождения активных субстанций в твердых лекарственных формах. Будучи компанией с полным спектром предоставляемых ингредиентов и оказываемых услуг, компания Merck оказывает всестороннюю поддержку в оптимизации процесса разработки и снижения времени вывода препарата на рынок

Портфель наших продуктов включает широкий ряд ингредиентов: от наполнителей и связующих, таких как маннитол распылительной сушки для оптимизации профилей фармакокинетики/фармакодинамики и специальные полимеры для экструзии горячего расплава, до противоионов, таких как, например, меглу-

мин для повышения растворимости активной субстанции.

Parteck® ODT из нашего продуктового семейства маннитолов специально разработан для производства таблеток, диспергируемых в полости рта. На основе Parteck® ODT вы можете даже создавать покрытия для таблеток без изменения скорости дезинтеграции. Для разработчиков это оз-

начает, что можно получить таблетку с повышенной прочностью и стабильностью, длительным сроком годности, а также создать уникальный привлекательный продукт, который будет выделяться на фоне конкурентов. Были проведены исследования, в которых наряду с водными системами покрытий других производителей исследовались рецептуры на основе Parteck® ODT. Последние приводили к получению гладких покрытий, которые повышали прочность таблетки в два раза, при этом время дезинтеграции оставалось неизменным. Это открывает дверь для совершенно нового применения Parteck® ODT как функционального вспомогательного ингредиента для систем немедленного высвобождения.

Одной из самых сложных проблем в разработке лекарственных препаратов является низкая растворимость активных фармацевтических ингредиентов (АФИ). Для преодоления этой трудности мы разработали продукт Parteck® MXP – новый ингредиент на основе поливинилового спирта, способствующий повышению растворимости широкого ряда АФИ с низкой биодоступностью.

Parteck® MXP специально разработан для применения в процессах экструзии горячего расплава (ЭГР). Данная технология только начинает получать популярность у фармацевтических производителей для повышения биодоступности АФИ. Новый ингредиент позволяет получить более чем 30% нанесение АФИ, в то время как, обычно, при использовании других продуктов, это значение не превышает 10–15%. Экструдаты на основе Parteck® MXP проявляют отличную стабильность в различных условиях.

Parteck® MXP сохраняет стабильность при температурах выше 200°C, когда другие ингредиенты уже разлагаются. Поэтому применение Parteck® MXP расширяет возможности применения метода ЭГР для АФИ с более высокими температурами плавления. Далее экструдат без проблем вводится в рецептуру различных конечных лекарственных форм с немедленным или модифицированным профилем высвобождения.

Если рассмотреть, насколько тесно органические противоионы, такие как меглумин, взаимодействуют с активной субстанцией, то становится очевидным, что необходимо применять продукт самого лучшего качества. В отличие от многих производителей, мы можем предложить не только технические марки, но и меглумин качества АФИ в соответствии с требованиями европейских нормативов ICH Q7. Чистота и качество такого уровня делают наш продукт идеальным вариантом для применения в качестве противоиона для растворения АФИ в крови. А если он используется вместо натрия в комплексах с АФИ, то наш меглумин помогает также повысить растворимость плохо растворимых активных субстанций.

Нормативная поддержка пользователей нашего меглума настолько же уникальна, как качество самого продукта, и включает помощь в регистрации по процедуре CEP (актуально для Украины) и US-DMF. Меглумин применяют в препаратах для рентгенологического обследования, лечения лейшманиоза (человеческий и ветеринарный препараты), противовоспалительного ис-

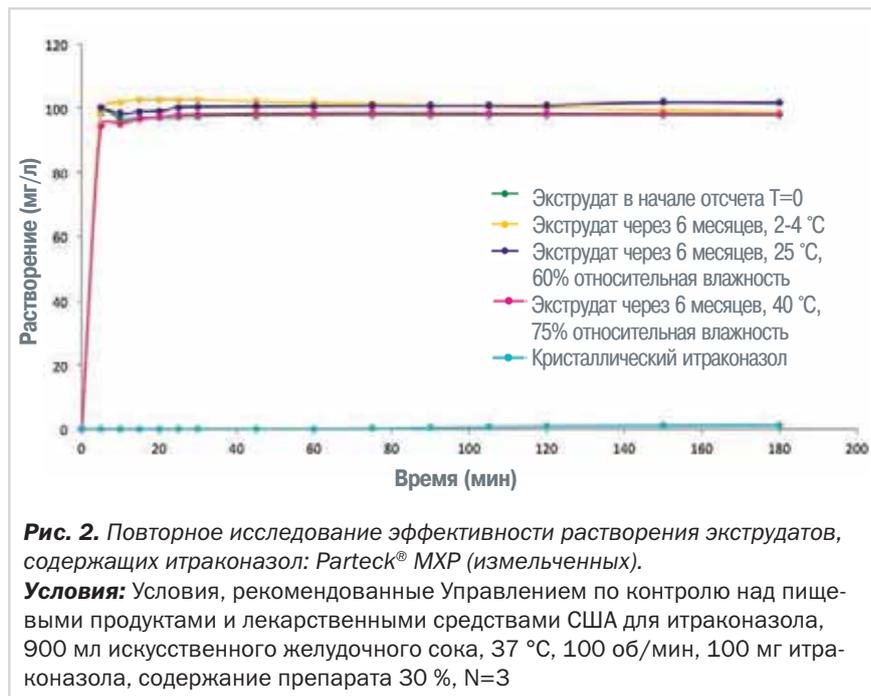


Рис. 2. Повторное исследование эффективности растворения экстрадатов, содержащих итраконазол: Parateck® MXP (измельченных).

Условия: Условия, рекомендованные Управлением по контролю над пищевыми продуктами и лекарственными средствами США для итраконазола, 900 мл искусственного желудочного сока, 37 °C, 100 об/мин, 100 мг итраконазола, содержание препарата 30 %, N=3

пользования (ветеринария), а также в качестве противоиона для растворения АФИ в крови.

Это был лишь краткий обзор широкого портфеля сырьевых продуктов для фармацевтических производств. Разработки, а также поддержка, необходимая в применении продуктов, осуществляются в лаборатории исследования вспомога-

тельных ингредиентов компании Merck в г. Дармштадт, Германия. В этом центре сосредоточения многолетнего опыта компании наши высококвалифицированные специалисты готовы оказать вам поддержку в разработке рецептур на основе ваших активных субстанций на ультрасовременном оборудовании с помощью широкого спектра прогрессивных технологий. Мы с нетерпением ждем возможности совместной работы над вашими проектами и разработками новых рецептур.

Центр разработки рецептур компании имеет общую площадь более 500 квадратных метров и является объектом обширных инвестиций. В планы по развитию центра входит создание лабораторий с возможностью регулировать уровень влажности воздуха. В центре также проводятся тренинги и семинары по разработке рецептур для наших клиентов. ▣

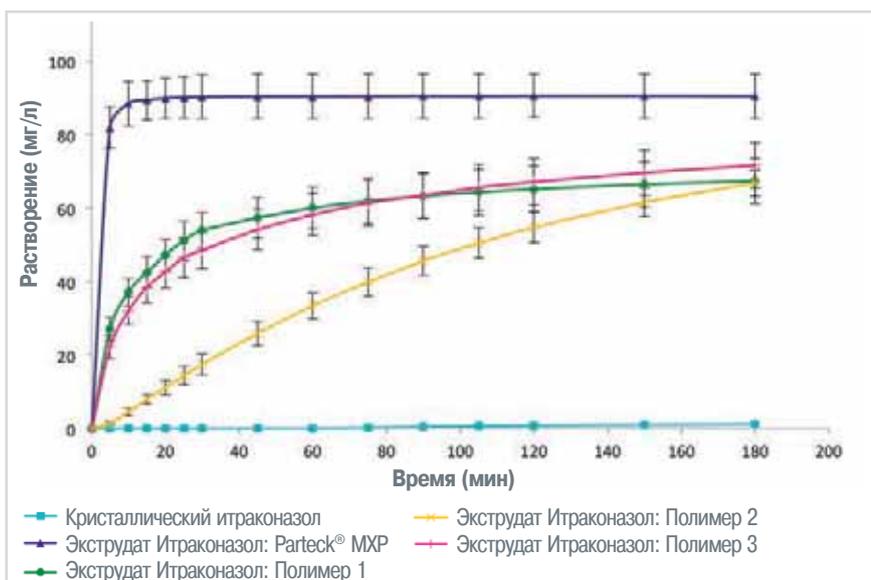


Рис. 1. Эффективность растворения экстрадатов итраконазола (измельченных).

Условия: Условия, рекомендованные Управлением по контролю над пищевыми продуктами и лекарственными средствами США для итраконазола, 900 мл искусственного желудочного сока, 37°C, 100 об/мин, 100 мг итраконазола, содержание препарата 30%, N=3

MERCK

Контактная информация:

ООО «Мерк»
115054, г. Москва, ул. Валовая, д. 35
Тел.: +7 (495) 937 33 04
E-mail: mm.russia@merckgroup.com
www.merckmillipore.com

