

Neusilin® – специализированный эксципиент

Полностью синтетический магнезия алюмометасиликат (MAS) с уникальными свойствами для улучшения доставки АФИ и повышения качества лекарственных препаратов

Neusilin® представляет собой полностью синтетический магнезия алюмометасиликат, который обладает исключительными свойствами наполнителя, улучшает доставку АФИ и повышает качество твердых лекарственных форм для перорального применения. Существует четыре типа Neusilin®, а два разных значения pH делают его универсальным эксципиентом для широкого спектра применений.

Neusilin®, существующий на фармацевтическом рынке уже более 60 лет, введен более чем в 1500 лекарственных препаратов. Данный продукт хорошо зарекомендовал себя среди разработчиков во всем мире в качестве вспомогательного вещества для составов, которые содержат антибиотики, масляные вещества, плохо растворимые в воде АФИ, травяные смеси, витамины и т. д.

Характеристики

1. Neusilin® представляет собой магнезия алюмометасиликат в форме мелкокристаллического порошка или гранул.
2. Эмпирическая формула Neusilin® – $Al_2O_3 \cdot MgO \cdot 1.7SiO_2 \cdot xH_2O$
3. Neusilin® является аморфным веществом, имеет очень большую удельную поверхность и обладает высокой адсорбционной способностью масла и воды.
4. Neusilin® имеет превосходный уровень сжимаемости, что позволяет изготавливать твердые лекарственные формы (таблетки) при низкой силе сжатия. Он также способствует улучшению твердости других наполнителей и связующих веществ в низкой концентрации.
5. Смешивание с Neusilin® помогает стабилизировать чувствительные к влаге и липофильные АФИ.
6. Neusilin® устойчив к воздействию тепла и имеет длительный срок хранения.
7. Доступны разные виды Neusilin®, отличающиеся объемной плотностью, содержанием воды, размерами частиц и значениями pH.
8. Neusilin® является хорошим носителем для самоэмульгирующихся систем доставки лекарственных веществ, твердых дисперсий и экструзии горячим расплавом.

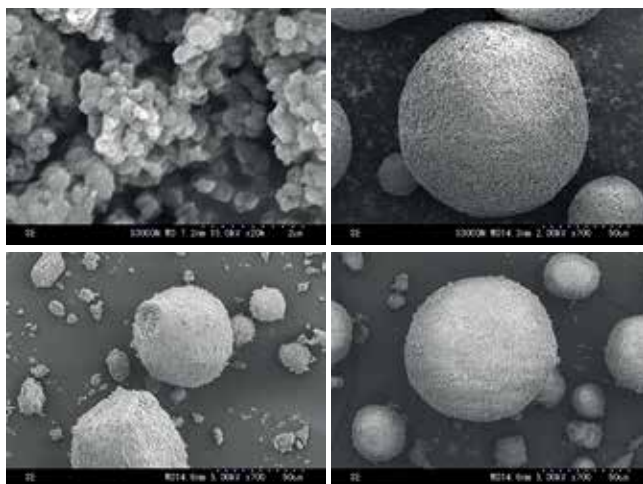
Общие свойства

Внешний вид	Белый порошок или гранулы
Агрегатное состояние	Аморфное вещество
Удельный вес	2,0 – 2,2
Растворимость	Практически нерастворим в воде и этаноле
Состав (%)	Al ₂ O ₃ : 29,1 – 35,5
	MgO: 11,4 – 14,0
	SiO ₂ : 29,2 – 35,6
Потери при высушивании	Менее 20 до 5% в зависимости от типа
CAS-номер	12511-31-8
EINECS-номер	235-682-0

Типы Neusilin®

UFL2	US2	S1	S2
Нейтральный	Нейтральный	Щелочной	Щелочной
Порошок	Гранулы	Гранулы	Гранулы
Низкое содержание воды	Низкое содержание воды	Высокое содержание воды	Низкое содержание воды

Электронные микрофотографии



Характерные свойства					
Тип		Щелочные		Нейтральные	
		S1	S2	UFL2	US2
Внешний вид		Белые гранулы	Белые гранулы	Белый порошок	Белые гранулы
Степень белизны (%)		> 95	> 95	> 95	> 95
Потери при высушивании (%) 110 °С, 7 ч		13 – 20	< 5	< 7	< 7
Насыпная плотность	Свободная насыпная масса (г/мл)	0,30 – 0,37	0,29 – 0,37	0,06 – 0,11	0,13 – 0,18
	Плотность после утряски (г/мл)	0,36 – 0,43	0,34 – 0,42	0,10 – 0,17	0,16 – 0,22
Удельный вес		2,0	2,2	2,2	2,2
Удельная площадь поверхности (м ² / г)*		110	110	300	300
Средний размер частиц (мкм)		112	115	3.1	106
Угол откоса (°)		30	30	45	30
Адсорбционная способность масла (мл/г)**		1,3	1,4	2,7 – 3,4	2,7 – 3,4
Адсорбционная способность воды (мл/г)		1,0	1,2	2,4 – 3,1	2,4 – 3,1
Кислотно–нейтрализующая способность (мл/г)***		≥ 210	≥ 210	≥ 210	≥ 210
рН (суспензия 4 %)****		8,5 – 10,0	8,5 – 10,0	6,0 – 8,0	6,0 – 8,0

* Площадь поверхности BET, метод адсорбции азота

** Японский промышленный стандарт по тестированию пигментов (JISK5101)

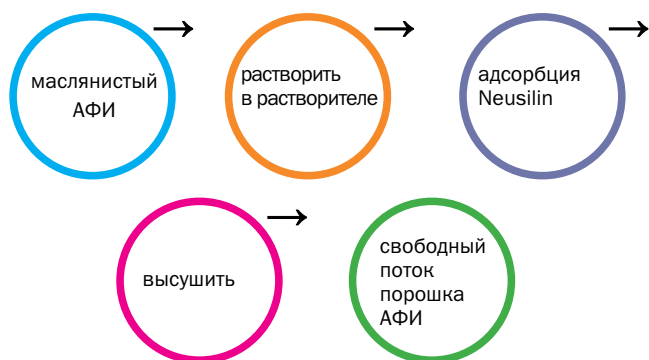
*** Количество 0,1 N соляной кислоты, нейтрализованное 1 г высушенного продукта (110 °С, 7 ч)

**** Взвесьте 2 г образца, добавьте воду, чтобы получить 50 мл. После перемешивания дайте постоять в течение 2 мин, измерьте рН, используя рН-метр

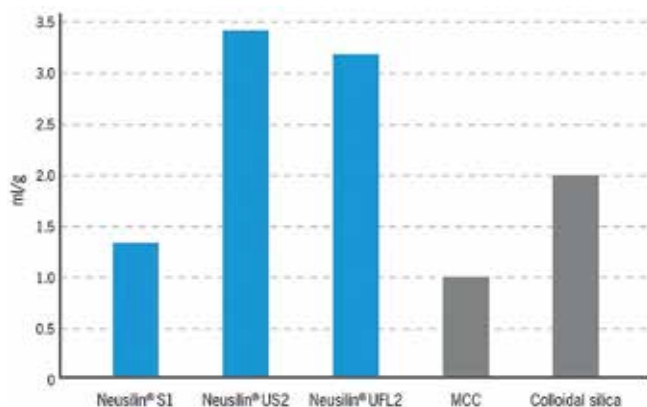
Типичные области применения и количества, необходимые для лекарственных препаратов				
Применение / функции	Количество (%)			
	S1	S2	UFL2	US2
Разбавитель для твердых лекарственных форм	30 – 90	30 – 90	30 – 90	30 – 90
Связующее вещество, усиливающее твердость и выступающее вспомогательным средством при дезинтеграции в таблетках	5 – 20	5 – 20	1 – 10	1 – 10
Улучшение сыпучести			0,5 – 5	
Антислеживающийся агент			0,5 – 5	
Затверждение жидких АФИ (например, превращение масла в порошок)			30 – 50	30 – 50
Применение для суспензий			1 – 5	
Стабилизация гигроскопичных АФИ			5 – 15	5 – 15
Твердая дисперсия, SMEDDS			20 – 50	20 – 50

Фармацевтическое применение

I. Превращение масла и экстрактов в порошок Схема



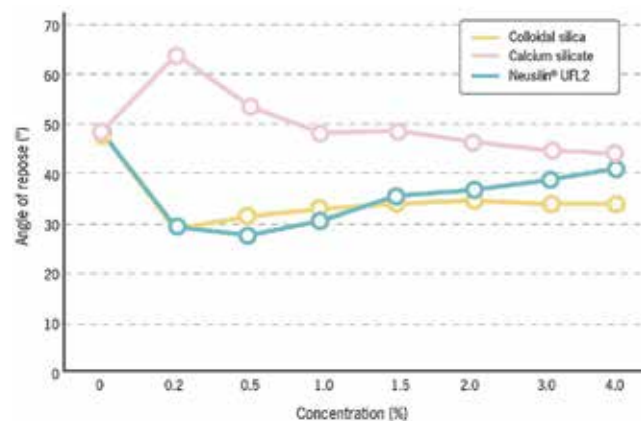
Адсорбционная способность масла



Neusilin® US2 и UFL2 показывают более высокую адсорбционную способность масла* по сравнению с МКЦ или коллоидным кремния диоксидом.

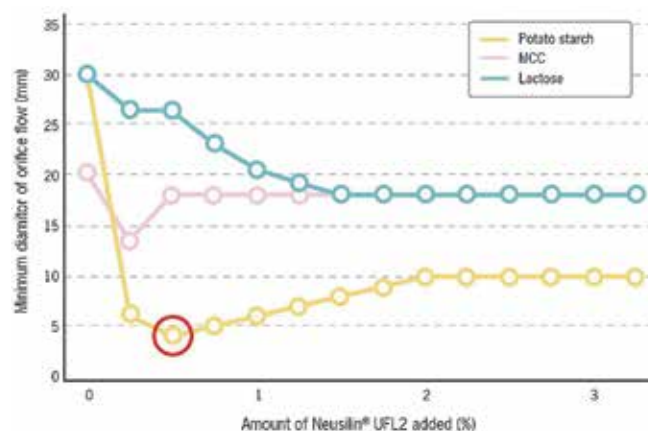
* Прямая адсорбция льняного масла.

II. Улучшение сыпучести с Neusilin® UFL2 Угол естественного откоса после добавления Neusilin® в картофельный крахмал



III. Предотвращение слеживания

Добавление 0,5 % Neusilin® UFL2 предупреждает слеживание



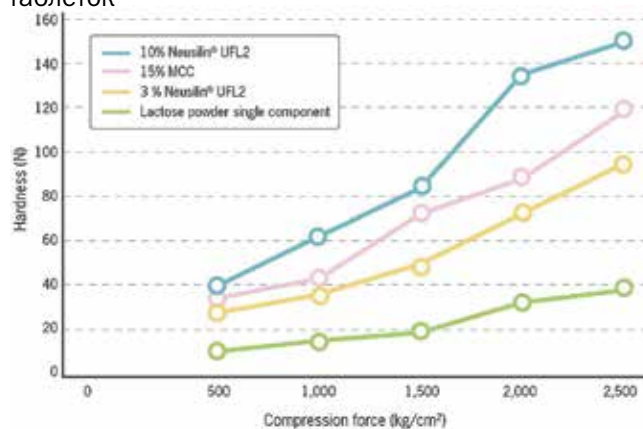
Пример предотвращения слеживания при высокой влажности с добавлением Neusilin® UFL2.



Условия: температура – 45 °С; относительная влажность – 75 %; длительность – 2 дня.

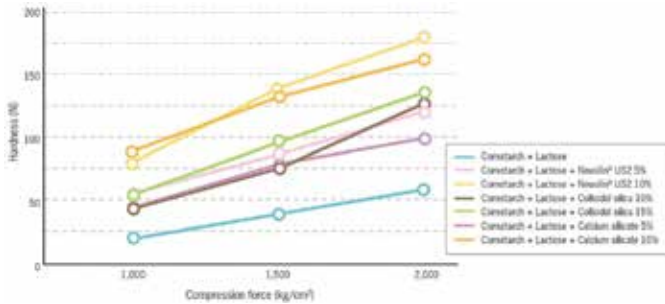
IV. Прессуемость

Neusilin® UFL2 способствует повышению твердости таблеток



Благодаря добавлению 10% Neusilin® UFL2 в таблетки с лактозой достигается более высокая твердость в сравнении с добавлением 5% Neusilin® UFL2 или 15% МКЦ.

Высококачественные таблетки при низкой силе сжатия

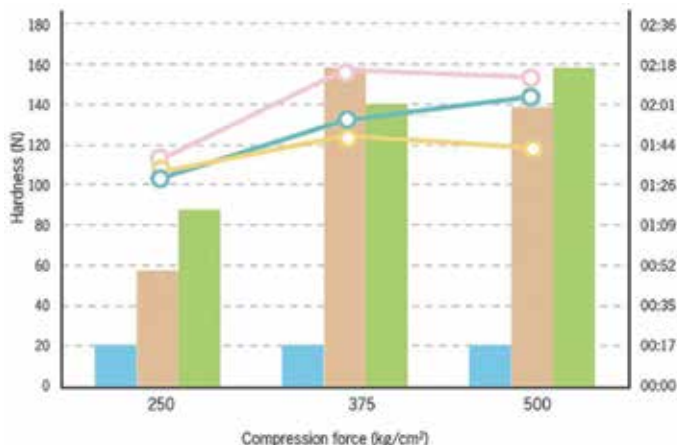
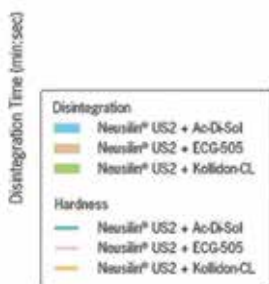


Сравнение твердости таблеток на основе кукурузного крахмала / лактозы, смешанных с Neusilin® US2 или коллоидным кремнием или кальция силикатом. Кукурузный крахмал, лактозу и эксципиент тщательно перемешивали. Перед таблетированием добавляли магния стеарат в качестве лубриканта. Прессование с Neusilin® US2 способствует достижению большей твердости таблеток в сравнении с использованием коллоидного кремния или кальция силиката.

V. Твердая дисперсия

Изготовление плохо растворимых в воде лекарств путем твердой дисперсии способствует значительному улучшению растворения и повышению биодоступности. Использование Neusilin® может помочь в решении проблем, связанных с таблетированием, и повысить эффективность диспергирования твердых частиц.

VI. Наиболее совместимые дезинтегранты с Neusilin®US2



Установлено, что наиболее совместимым дезинтегрантом с Neusilin® US2 являются натрия кроскармеллоза, поливинилпирролидон и кармеллоза кальция. Такие характеристики, как большая площадь поверхности и пористая природа Neusilin® US2, а также образование поперечных межмолекулярных связей натрия кроскармеллозы действуют синергетически, позволяя таблетке разбухать и увеличивать массу, поглощая воду, что приводит к ее быстрому распаду.

Neusilin® US2 способствует улучшению сыпучести и позволяет изготавливать достаточно твердые таблетки при низких силах сжатия. Увеличение твердости и повышение силы сжатия не влияет на время дезинтеграции.

Выводы

Благодаря использованию Neusilin® в разработках можно решать следующие задачи: улучшение сыпучести, превращение масла в порошок, повышение твердости таблетки, получение таблеток высокого качества при низких силах прессования, защита АФИ, использование более высокой загрузки АФИ.

Neusilin® является хорошим носителем для самоэмульгирующихся систем доставки лекарственных веществ, твердых дисперсий и экструзии горячим расплавом. ■



Контактная информация:

Для получения образца просим обращаться в компанию **Witec**, которая является эксклюзивным дистрибьютором:
 Одесса, 65101, Украина,
 ул. 25-й Чапаевской дивизии, 6/1, офис 134
 Тел. / факс: +38 (048) 777-91-73, 777-91-75, 705-16-01
 E-mail: office@witec.com.ua
 www.witec.com.ua

Москва, 11739, Россия, ул. Профсоюзная, 56, офис 23 – 28
 Деловой центр «Черри Тауэр»
 Тел.: +7 (495) 666-56-68, +7 (499) 110-81-09
 E-mail: office@witec.ru