

# 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.

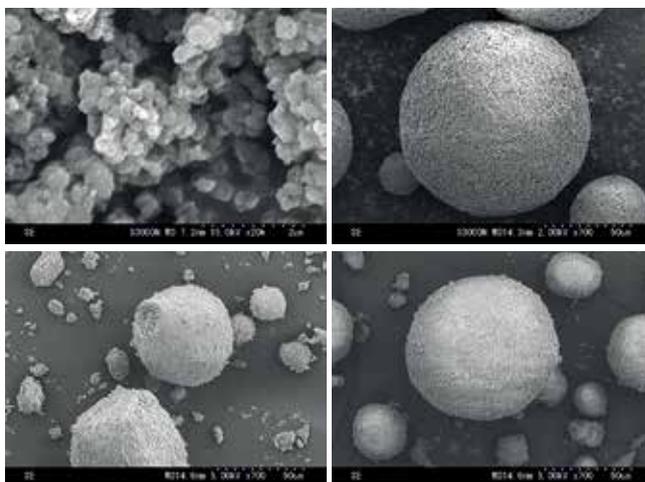
### Общие свойства

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 <sub>2</sub> O <sub>3</sub> : 29,1 – 35,5
	MgO: 11,4 – 14,0
	SiO <sub>2</sub> : 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 <sup>2</sup> / 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)

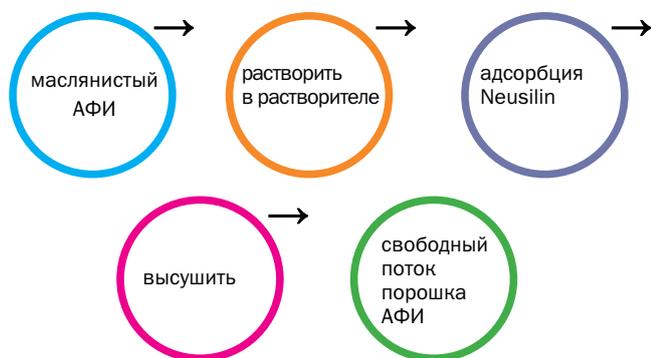
\*\*\* Количество 0,1 N соляной кислоты, нейтрализованное 1 г высушенного продукта (110 °С, 7 ч)

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

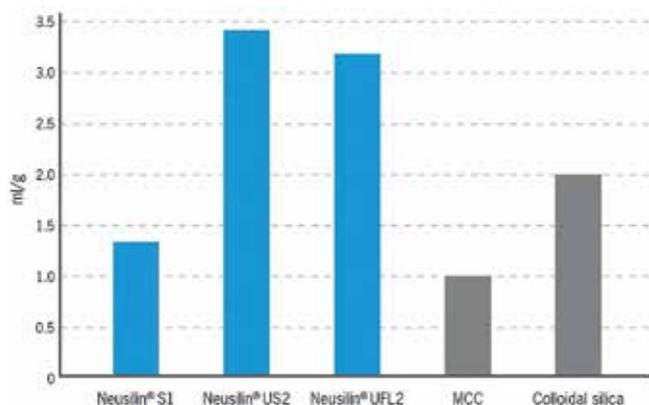
Типичные области применения и количества, необходимые для лекарственных препаратов				
Применение / функции	Количество (%)			
	S1	S2	UFL2	US2
Разбавитель для твердых лекарственных форм	30 – 90	30 – 90	30 – 90	30 – 90
Связующее вещество, усиливающее твердость и выступающее вспомогательным средством при 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



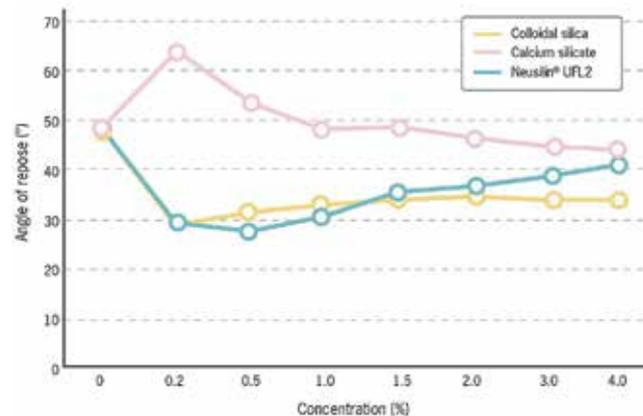
### Адсорбционная способность масла



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

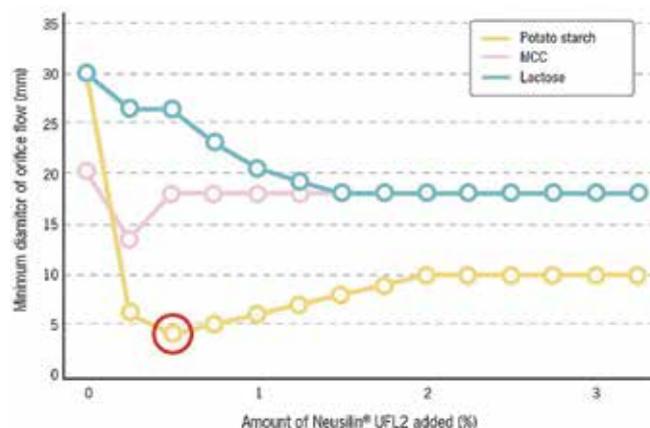
\* Прямая адсорбция льняного масла.

### 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



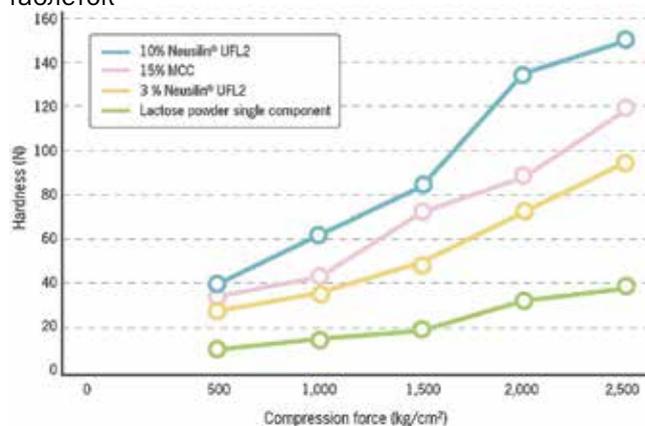
Пример предотвращения слеживания при высокой влажности с добавлением Neusilin® UFL2.



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

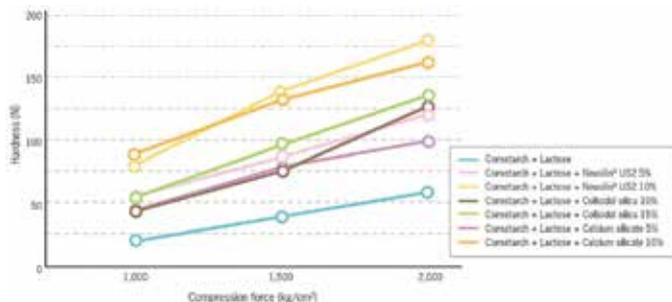
### IV. Прессуемость

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

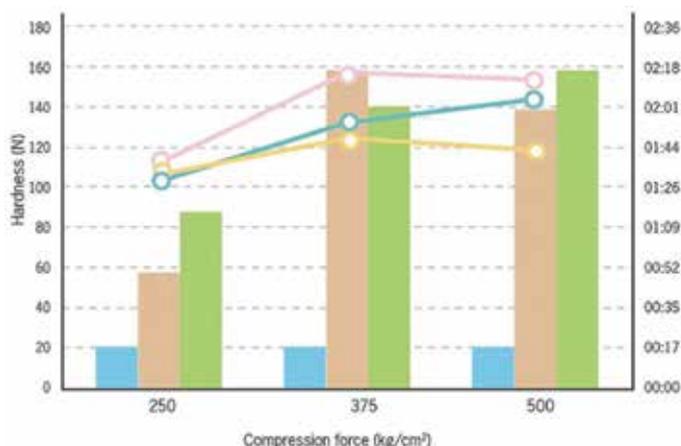
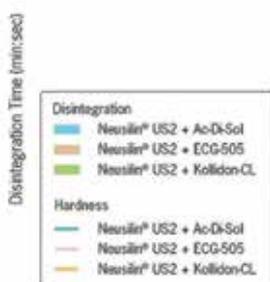


Сравнение твердости таблеток на основе кукурузного крахмала / лактозы, смешанных с Neusilin® US2 или коллоидным кремнием или кальция силикатом. Кукурузный крахмал, лактозу и эксципиент тщательно перемешивали. Перед таблетированием добавляли магния стеарат в качестве лубриканта. Прессование с Neusilin®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