



F-MELT®

Система эксципиентов для производства орально-диспергируемых и мягких жевательных таблеток

F-MELT® является запатентованной системой эксципиентов, полученных с помощью распылительной сушки, которую компания Fujii начала производить в 2005 г. F-MELT® разработана для изготовления орально-диспергируемых таблеток (ОДТ), которые быстро растворяются в полости рта без воды, а также является отличным эксципиентом для мягких жевательных таблеток.

F-MELT® позволяет производить таблетки с оптимальной твердостью и быстрой дезинтеграцией. Система отлично маскирует горький вкус субстанции.

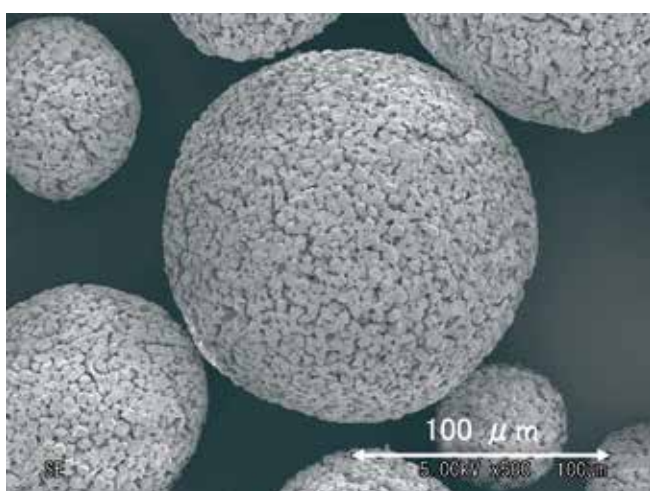
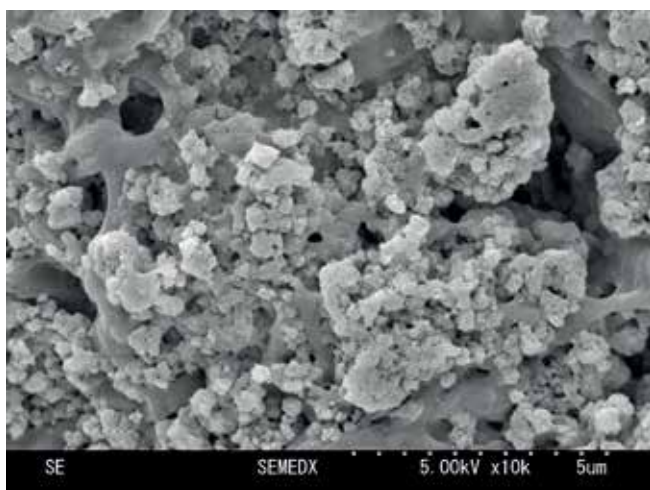
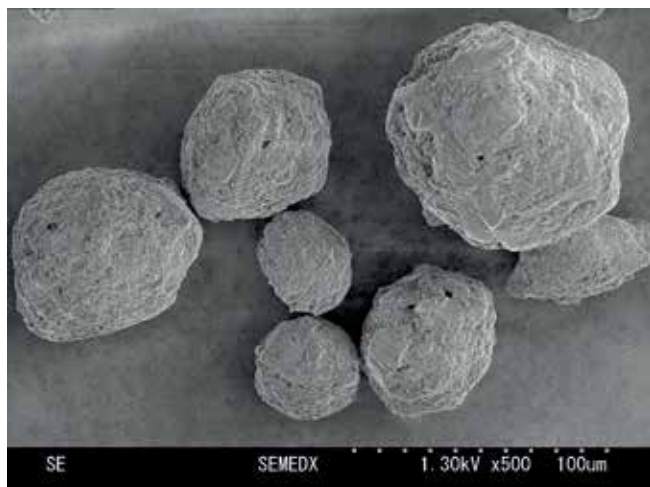
Особенности F-MELT®

1. Смесь эксципиентов для прямого прессования
2. Готовая к использованию система эксципиентов для производства ОДТ
3. Время дезинтеграции – менее 30 с
4. Хорошо сыпучий порошок, состоящий из частиц сферической формы
5. Возможна загрузка более чем 50 % АФИ
6. Достижимая твердость таблетки составляет более 50 N
7. Приятное ощущение во рту

Виды и общие свойства F-MELT®

| Показатель | Тип С Для фармацевтического инутрицевтического применения | Тип М Для фармацевтического применения | Тип F1 Длянутрицевтического применения |
|---|---|--|---|
| Внешний вид | Порошок белого или бледно-желтого цвета | | |
| Потери при высушивании, % | 1,3 | 1,8 | 5,9 |
| Свободная насыпная плотность, г / мл | 0,54 | 0,56 | - |
| Насыпная масса после уплотнения, г / мл | 0,65 | 0,65 | - |
| Среднее распределение частиц по размерам, мкм | 120,8 | 122,3 | 139,0 |
| Угол откоса, ° | 34 | 33 | 31 |
| Ингредиенты | D-маннитол Ксилитол Микрокристал- лическая целлюлоза (МКЦ) | D-маннитол Ксилитол МКЦ Кросповидон Neusilin® | Восковой рисовый крахмал МКЦ Fujicalin® |

Электронные микрофотографии F-MELT®



F-MELT® типа F1 – порошок, высушенный с помощью спреевой сушки (× 500)

Стабильность

Срок хранения F-MELT® – 3 года от момента даты производства.

Приведенные графики подтверждают стабильность F-MELT® на протяжении всего срока хранения.

F-MELT® типов С и М.

Рецептура: F-MELT® 99,6 % + магния стеарат 0,4 %
Условия таблетирования: \varnothing 8 мм, 200 мг/ таблетку, 15 об / мин, 33 N

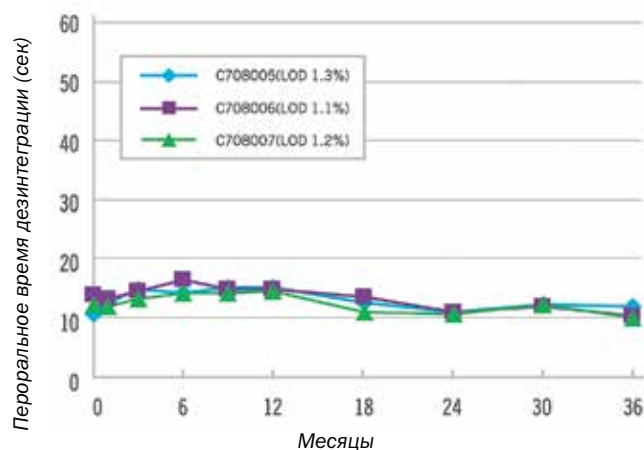
Машина для таблетирования: HT-AP18SS-II (производитель: Hata Iron Works Co., Ltd.)

Хранение: в алюминиевом мешке с уплотнителем при температуре 30°C и относительной влажности 65 %

После определенного времени хранения были изготовлены таблетки-плацебо. Время дезинтеграции в течение всего срока хранения соответствовало требованиям Фармакопеи.

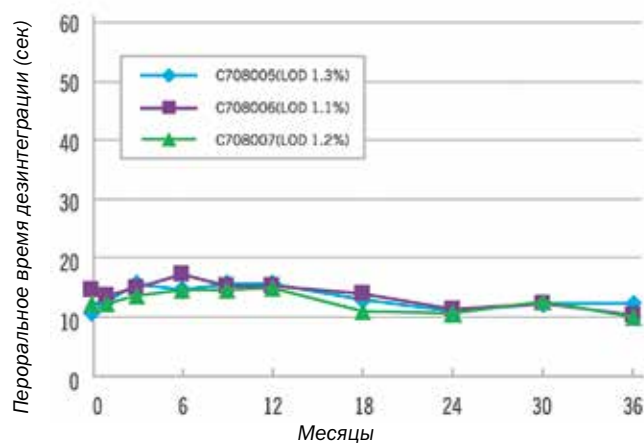
Тип С

Время дезинтеграции при 33 N



Тип М

Время дезинтеграции при 33 N



Фармацевтическое применение F-MELT® типов С и М

I. Примеры рецептов – прямое прессование

1. Рецепт ацетаминофена с F-MELT® типов С и М

| Ацетаминофен, масс. % | 30,0 | 40,0 | 30,0 | 30,0 | 40,0 | 30,0 |
|-------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|
| F-MELT® типа С, масс. % | - | - | - | 69,6 | 59,6 | 69,6 |
| F-MELT® типа М, масс. % | 69,6 | 59,6 | 69,6 | - | - | - |
| Магния стеарат, масс. % | 0,4 | 0,4 | 0,4 | 0,4 | 0,4 | 0,4 |
| Сила прессования, кН | 5,4 – 5,7 | 5,9 – 6,4 | 7,5 – 8,0 | 5,5 – 5,8 | 8,1 – 8,7 | 9,0 – 9,5 |
| Твердость таблетки, N | 36,4 | 30,2 | 59,8 | 31,7 | 36,6 | 49,1 |
| Время дезинтеграции, с | 20,2 | 20,8 | 45,5 | 14,6 | 21,5 | 66,5 |
| Ощущение во рту | Очень приятное | Очень приятное | Очень приятное | Очень приятное | Очень приятное | Очень приятное |

Загрузка ацетаминофена на 30 – 40 % может снизить твердость таблетки до значения между 30 и 35 N при сохранении времени дезинтеграции в течение 30 с. При более высоких усилиях сжатия можно достичь твердости таблетки выше 50 N. Однако время оральной дезинтеграции имеет тенденцию незначительно увеличиваться. Для уменьшения времени дезинтеграции рекомендуют использовать дополнительные эксципиенты или заменить лубрикант.

Пример

В рецептуре F-MELT® с ацетаминофеном использовались дополнительные эксципиенты, такие как кукурузный крахмал, карбоксиметилцеллюлоза (КМЦ), кросповидон, гидроксипропилкрахмал (ГПК) и магния стеарат в качестве лубриканта.

| Ацетаминофен, масс. % | 30,0 | 30,0 | 30,0 | 30,0 |
|------------------------------------|--------------------|-------------|-------------|-----------|
| F-MELT® типа С, масс. % | 49,6 | 49,6 | 64,6 | 49,6 |
| Другие эксципиенты, масс. % | Кукурузный крахмал | КМЦ | Кросповидон | ГПК |
| | 10 | 20 | 5 | 10 |
| | МКЦ | - | - | МКЦ |
| | 10 | - | - | 10 |
| Магния стеарат, масс. % | 0,4 | 0,4 | 0,4 | 0,4 |
| Сила сжатия, кН | 6,2 – 6,6 | 11,3 – 11,8 | 6,9 – 7,4 | 6,2 – 6,7 |
| Твердость таблетки, N | 50,0 | 50,7 | 53,0 | 59,0 |
| Время дезинтеграции согласно JP, с | 17,4 | 22,5 | 12,5 | 19,3 |
| Время дезинтеграции, с | 16,8 | 21,2 | 9,0 | 20,1 |
| Прочность таблеток на истирание, % | 0,25 | 0,14 | 0,10 | 0,18 |

Таблетки F-MELT® с ацетаминофеном достигли твердости 50 N и времени дезинтеграции менее 30 с при низком уровне хрупкости.

II. Примеры рецептов – влажная грануляция

1. Рецепт лоратадина с F-MELT® типа М

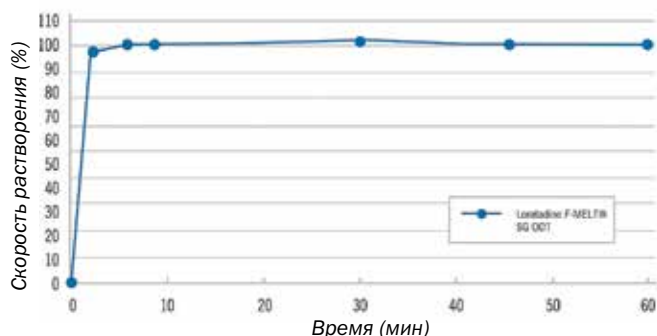
| Рецептура | |
|--|----------|
| Растворитель + смесь лоратадина с F-MELT® типа М (1 : 5) | 60 мг |
| F-MELT® типа М | 139,2 мг |
| Магния стеарат | 0,8 мг |
| Итого | 200 мг |
| Характеристики таблетки | |
| Твердость таблетки, N | 47,6 |
| Время дезинтеграции по Фармакопее, с | 11,13 |
| Пероральное время дезинтеграции ОДТ-101*, с | 13,38 |



Условия таблетирования: \varnothing 8 мм, 200 мг / таблетку, ротационная машина для таблетирования

*Оборудование для измерения ОДТ (Toyama-SangyoCo., Ltd.)

Профиль растворения ОДТ с лоратадином и F-MELT®



Исследование профиля растворения проводили согласно JP (рН 1,2, 900 мл, 37 ° С, скорость лопасти 50 об / мин).

Влажная грануляция лоратадина и F-MELT® типа М с растворителем (вода : этанол – 30 : 70) улучшает растворение лоратадина, который сам по себе является плохо растворимым в воде АФИ. Скорость растворения ОДТ с лоратадином и F-MELT® может достигать 100 % менее чем за 10 мин.

Нутрицевтическое применение F-MELT® типов С и F1

Прямое прессование

1. Рецептатура витамина В₁₂ с F-MELT® типа С

Витамин В₁₂ используется в качестве пищевой добавки и потребляется в микрограммах. Дезинтегрируемые таблетки витамина В₁₂ (500 мкг) были приготовлены с использованием F-MELT® типа С.

Рецептура витамина В₁₂ с F-MELT® типа С (V.В₁₂ 500 μ г / таблетку):



| Рецептура | Масса, г |
|-------------------------|----------|
| Витамин В ₁₂ | 1,0 |
| F-MELT® типа С | 578,2 |
| Тальк | 4,0 |
| Ароматизатор «Клубника» | 12,0 |
| Аспартам | 1,8 |
| Глицерил бегенат | 3,0 |
| Итого | 600 |

Характеристики таблетки витамина В₁₂ с F-MELT® типа С (\varnothing 10 мм, 300 мг, плоская таблетка)

| | |
|--|-------|
| Твердость таблетки согласно JP, N | 50,8 |
| Среднее время дезинтеграции, с (N = 5) | 19,87 |
| Время дезинтеграции, с | 9,9 |

Условия таблетирования: ротационная таблетующая машина (HT-AP18SS) с 15 об / мин

Сила сжатия – 4,8 – 5,2 kN

Фармакопия и нормативная информация

Тип С: соответствует японским фармацевтическим эксципиентам. Все компоненты соответствуют USP-NF, JP и EP. US DMF тип IV.

Тип М: соответствует японским фармацевтическим эксципиентам. Все компоненты соответствуют USP-NF и JP / JPC.

Безопасность

F-MELT® типов С и М

Компоненты F-MELT® типов С и М безопасны при использовании в качестве эксципиента для фармацевтических целей. Тип С также подходит для применения в нутрицевтических / пищевых продуктах. Компоненты типа С имеют E-номера (Директива ЕС по пищевым продуктам) и перечислены в CFR 21 (США) и в Списке приемлемых немедицинских ингредиентов (Канада).

Максимальная суточная доза типов С и М составляет 5,875 г.

F-MELT® F1

F-MELT® типа F1 не содержит остаточных органических растворителей и предназначен для использования в нутрицевтической / пищевой промышленности.

Такие документы, как TSE / BSE, Non-GMO и Сертификат о неаллергичности, доступны по запросу.

Выводы:

F-MELT® – прекрасный эксципиент для изготовления орально-диспергируемых и жевательных таблеток. F-MELT® позволяет производить таблетки с оптимальной твердостью и быстрой дезинтеграцией. Отлично маскирует горький вкус субстанции. ■

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