

Comprimidos especiales. Otras formas sólidas de administración de fármacos

TEMA 7

Calvo B, Esquisabel A, Hernández R, Igartua M

Tecnología Farmacéutica: Formas Farmacéuticas. OCW 2015

Comprimidos que se mantienen en la cavidad oral

- Comprimidos bucales
- Comprimidos sublinguales
- Comprimidos bucodispersables
- Comprimidos para chupar
- Comprimidos mucoadhesivos

Comprimidos orales para ingestión

- Comprimidos convencionales
- Comprimidos masticables
- Comprimidos multicapa
- Comprimidos recubiertos
- Comprimidos gastrorresistentes
- Comprimidos de liberación modificada

Comprimidos destinados a dispersarse o disolverse antes de la administración

- Comprimidos efervescentes
- Comprimidos solubles
- Comprimidos dispersables

Comprimidos administrados por otra vías

- Comprimidos vaginales
- Comprimidos de implantación s.c.

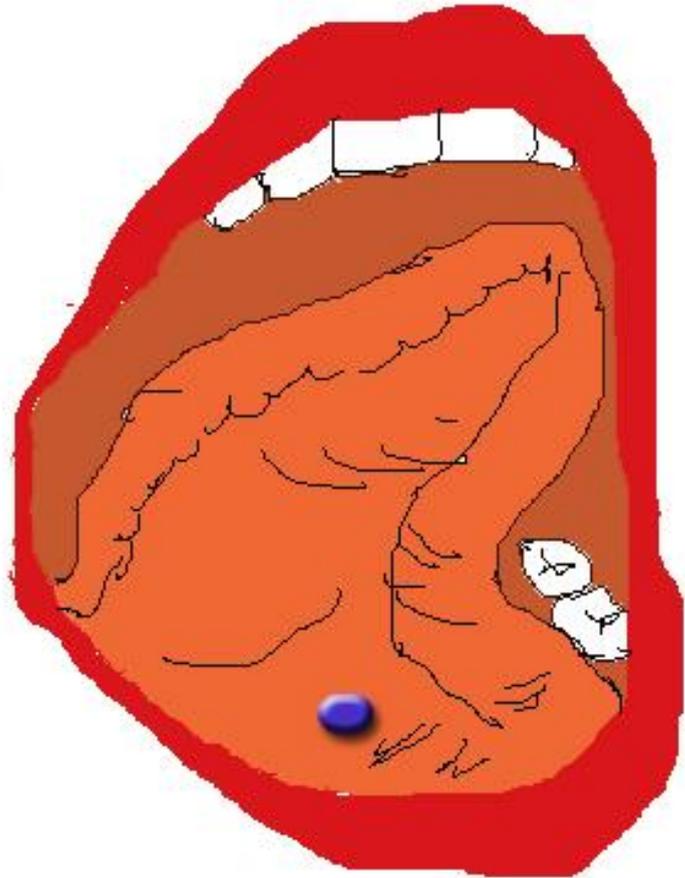
Sistemas matriciales

Sistemas osmóticos

Sistemas de intercambio iónico

Comprimidos flotantes

PARA MANTENER EN LA CAVIDAD ORAL



Se mantienen debajo de la lengua
Liberación inmediata, acción general

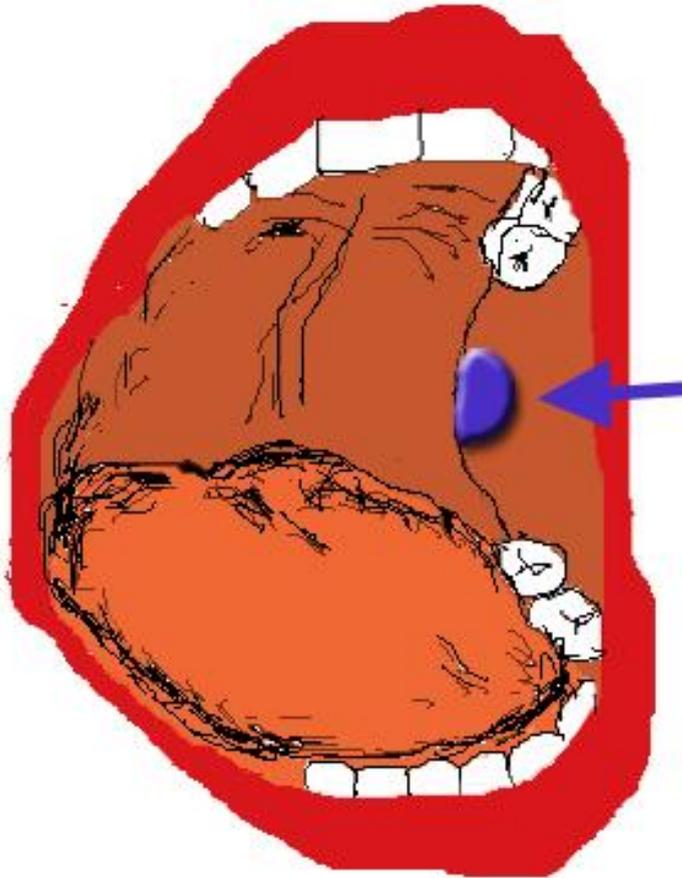
Utilidad:

- a) Administración de pa que se absorben mal o se degradan a nivel intestinal.
- b) Administración de pa que se absorben rápidamente en la mucosa sublingual (situaciones de emergencia)

Características:

- Pequeño tamaño, forma lenticular, poco espesor

Nitroglicerina, clorhidrato de isoproterenol, dinitrato de isosorbide, tetranitrato de eritritol



Deben permanecer en la boca
t prolongados (30-60 min)

Utilidad:

a) Terapia de sustitución
hormonal

Características:

Componentes finamente divididos
Utilización de polímero pp adhesivas

largos t disgregación

Metiltestosterona, propionato
de testosterona

Preparaciones destinadas a ser chupadas para obtener un efecto local o general.

Se preparan por compresión



Con permiso de Boehringer Ingelheim (consultado el 13-04-2015)

Lisozima 5 mg
Papaína 2 mg
Bacitracina 3 mg
Sorbitol
Sacarina
Esencia de menta
Estearato magnésico

Destinadas a disolverse o desintegrarse lentamente en la boca. Son formulaciones para chupar. Efecto local (cavidad oral o garganta) o en algunos casos sistémico

Excipientes:

- Base aromatizada y edulcorada. Colorantes.

Pastillas para chupar: preparaciones duras preparadas por moldeo

Pastillas blandas: flexibles y blandas preparadas por moldeo de mezclas que contienen polímeros o gomas naturales o sintéticos, y edulcorantes.



Tiia Monto Publicada en Wikimedia Commons con licencia Creative Commons Genérica de Atribución/Compartir-Igual 4.0.
https://upload.wikimedia.org/wikipedia/commons/9/90/Vicks_Fruity_Fresh_-_Lemon.jpg (consultada el 12-04-2015)

Amaia Esquisabel® 2015

Con permiso de Ricola, (consultado el 13-04-2015)

Contienen uno o varios principios activos destinados a ser absorbidos a través de la mucosa bucal durante un periodo prolongado de t con una acción general

Se preparan por compresión, contienen polímeros hidrófilos

saliva



hidrogel flexible



adhesión mucosa

Se colocan en la boca y se dispersan rápidamente en contacto con la saliva antes de tragarse.

POR COMPRESIÓN

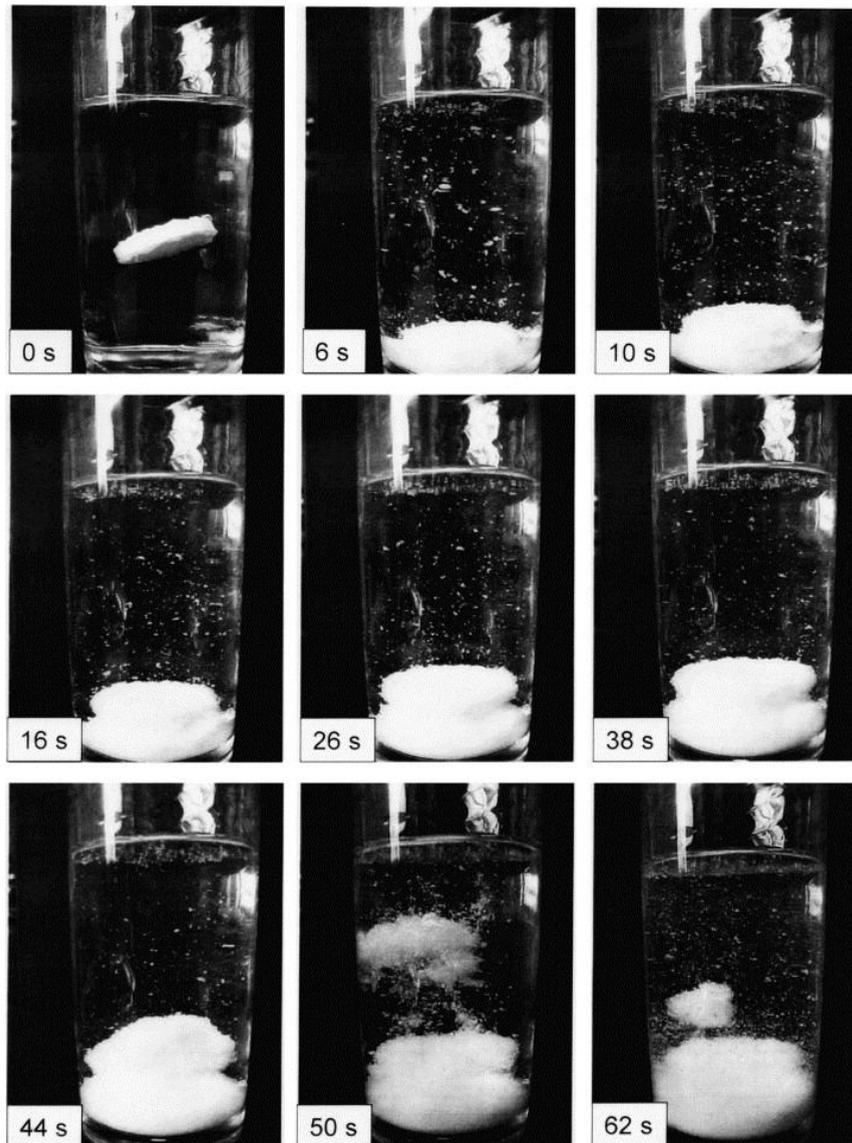
POR LIOFILIZACIÓN: LIOTABS

Obtenido por liofilización de un pequeño volumen de líquido quedando al final como una masa sólida con un aspecto parecido a un comprimido

Feldene flas[®] (piroxicam)

Ensayo de disgregación (2.9.1):

tiempo de disgregación < 3 min



Schiermeier and Schmidt, Eur J Pharma
Sci, 15, 295–305, 2002

OTROS COMPRIMIDOS ORALES PARA INGESTIÓN

Se fragmentan con los dientes y luego se tragan

Utilidad:

- Pacientes con dificultades para deglutir
- Para conseguir rápida disgregación (antiácidos)

Características:

- Diluyente: manitol
- Edulcorantes
- No disgregantes
- No necesario test de disgregación

Preparados vitamínicos,
antiácidos, ac acetilsalicílico,....

Están constituidos por distintos estratos que incorporan D iguales o distintas de uno o distintos fármacos.

Se hacen comprimiendo distintas mezclas o granulados



Con permiso de Bosch Packaging Technology
(12-04-2015)



Con permiso de Bosch Packaging Technology
(12-04-2015)

Son comprimidos de liberación retardada que están destinados a resistir la acción del jugo gástrico y a liberar el pa en el fluido intestinal.

Disgregación:

1-3 h ácido clorhídrico 0,1M

tampón fosfato 6,8 (60 min)

Son comprimidos recubiertos o no, con excipientes especiales o preparados con metódicas especiales diseñados para:

modificar la V de liberación

el lugar o

el tiempo

al cual el fármaco es liberado.

**COMPRIMIDOS DESTINADOS A DISPERSARSE O DISOLVERSE
ANTES DE LA ADMINISTRACIÓN**

Rápida disolución con liberación de CO₂

Características:

- Ácido + carbonato o bicarbonato
- (cítrico, tartárico, succínico, algínico,...)
- Edulcorantes: sacarina
- Lubricantes solubles

Métodos preparación

- Granulación vía seca
- Granulación vía húmeda acuosa (2 granulados)
- Granulación vía húmeda anhidra

Test de disgregación

comprimido en agua (200 mL) 15-25°C

t < 5 min (6 unidades)

Analgésicos, descongestivos, antihistamínicos,...



Están destinados a disolverse en agua antes de su administración

La solución obtenida puede ser ligeramente opalescente debido a los excipientes.

Ensayo de disgregación:

Agua 15-25°C, equipo disgregación

tiempo de disgregación < 3 min

Están destinados a dispersarse en agua antes de su administración

Se obtiene una dispersión homogénea.

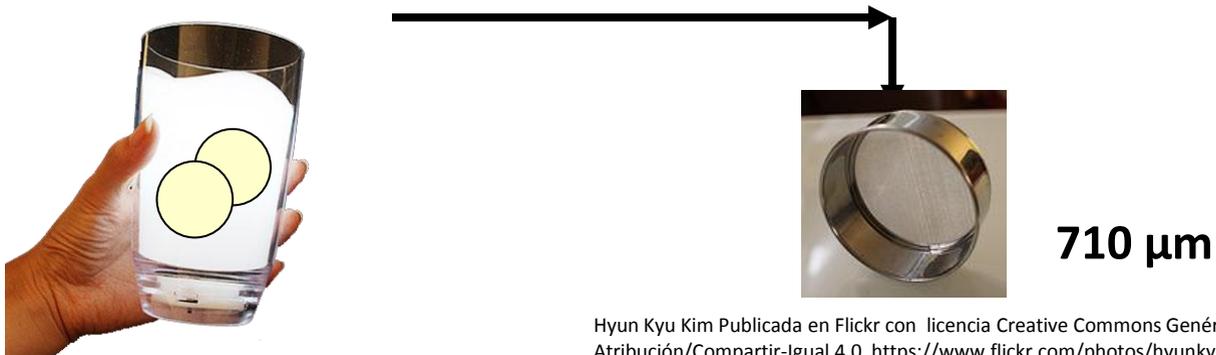
Ensayo de disgregación:

Agua 15-25°C, equipo disgregación

tiempo de disgregación < 3 min

Ensayo de finura de la dispersión:

2 comprimidos en 100 mL de agua



Hyun Kyu Kim Publicada en Flickr con licencia Creative Commons Genérica de Atribución/Compartir-Igual 4.0. <https://www.flickr.com/photos/hyunkyukim/8737059894> (consultada el 12-04-2015)

COMPRIMIDOS ADMINISTRADOS POR OTRAS VÍAS DISTINTAS A LA ORAL

Están diseñados para disolverse y liberar lentamente el pa en la cavidad vaginal

Utilidad:

- Acción local en la mucosa: tratamiento de infecciones (antibacterianos, antifúngicos, antisépticos y astringentes)
- Acción sistémica (esteroides)

Características:

- Excipientes solubles y forma ovoidea
- Tamponar a pH próximo a fisiológicos
- tiempo de disgregación < 30 min

Implantación a nivel s.c. mediante técnica quirúrgicas o dispositivos apropiados

Utilidad:

- Acción sostenida
- Utilización en el campo de la medicina veterinaria (hormonas)

Características:

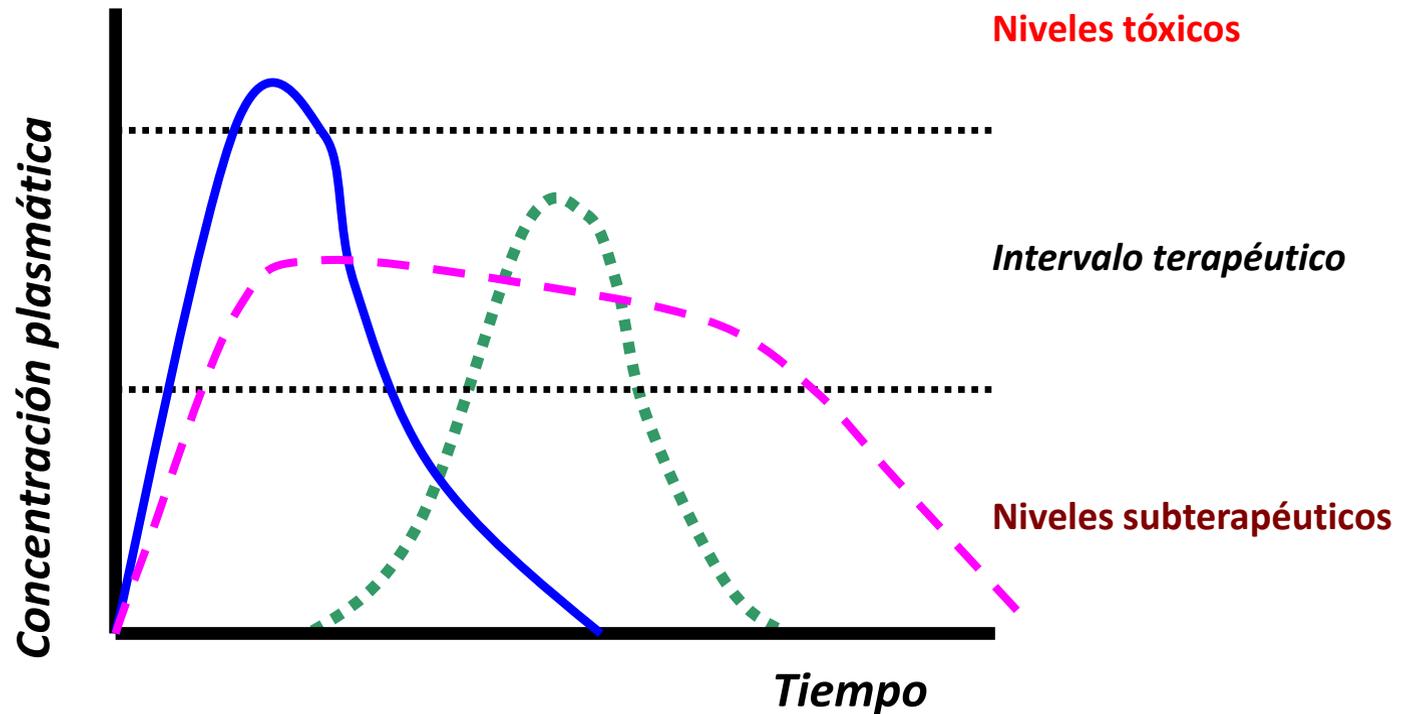
- Tamaño reducido: cilindros o discos de 3 mm
- Esterilidad, apirogenicidad
- Solubilidad total
- Tolerancia local

Formas farmacéuticas de acción sostenida: vía oral

FORMAS DE LIBERACIÓN SOSTENIDA O PROLONGADA

FORMAS DE LIBERACIÓN RETARDADA

FORMAS CONVENCIONALES



Disminución de la frecuencia de administración

Prevención de efectos secundarios

Mantenimiento de nivel terapéutico durante más tiempo

Reducción en la cantidad absorbida

Aumento de la variabilidad de la absorción

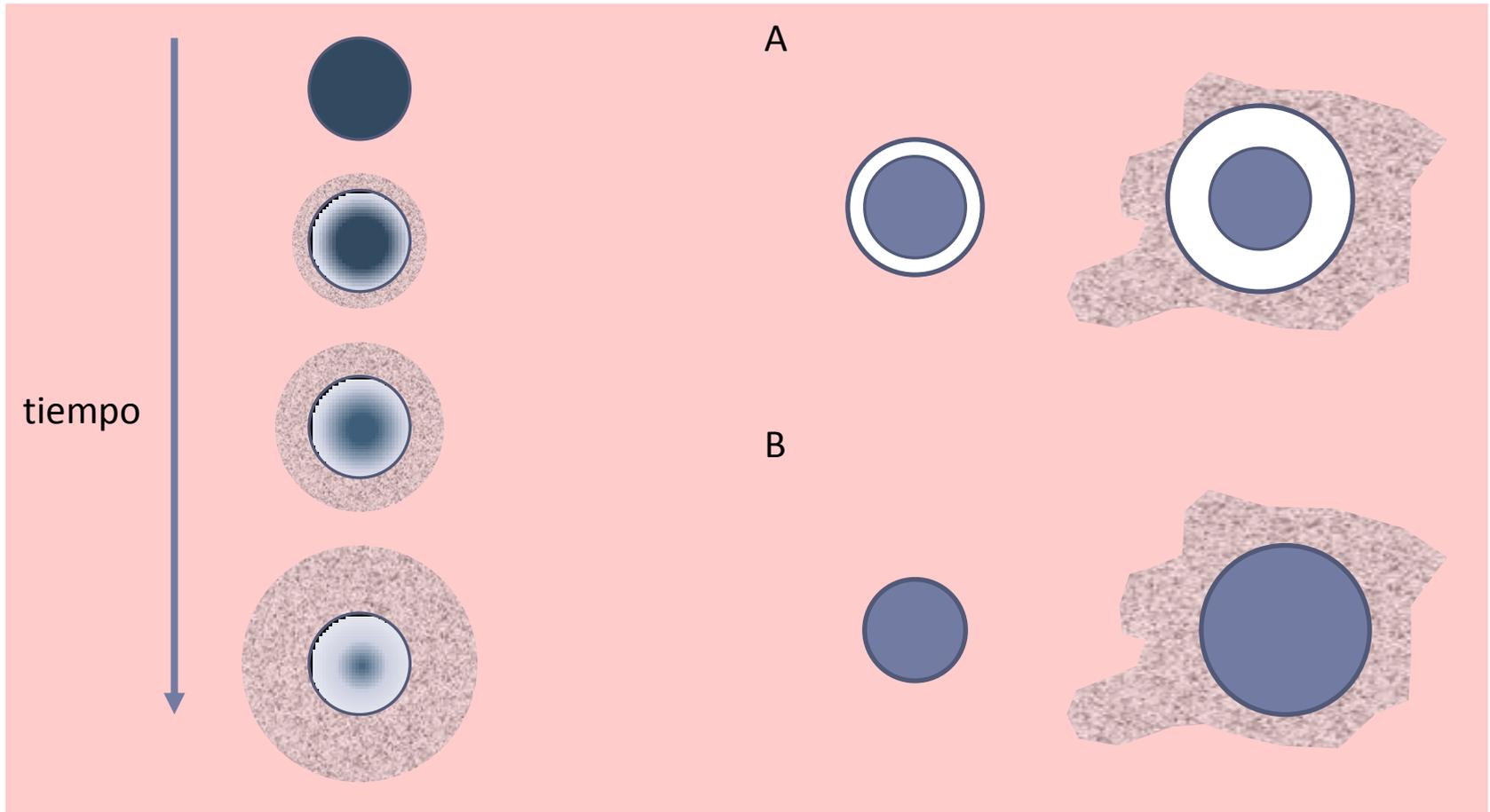
Retraso en el comienzo de la actividad terapéutica

Problemas de intoxicación

Formulaciones más complejas

Menor flexibilidad

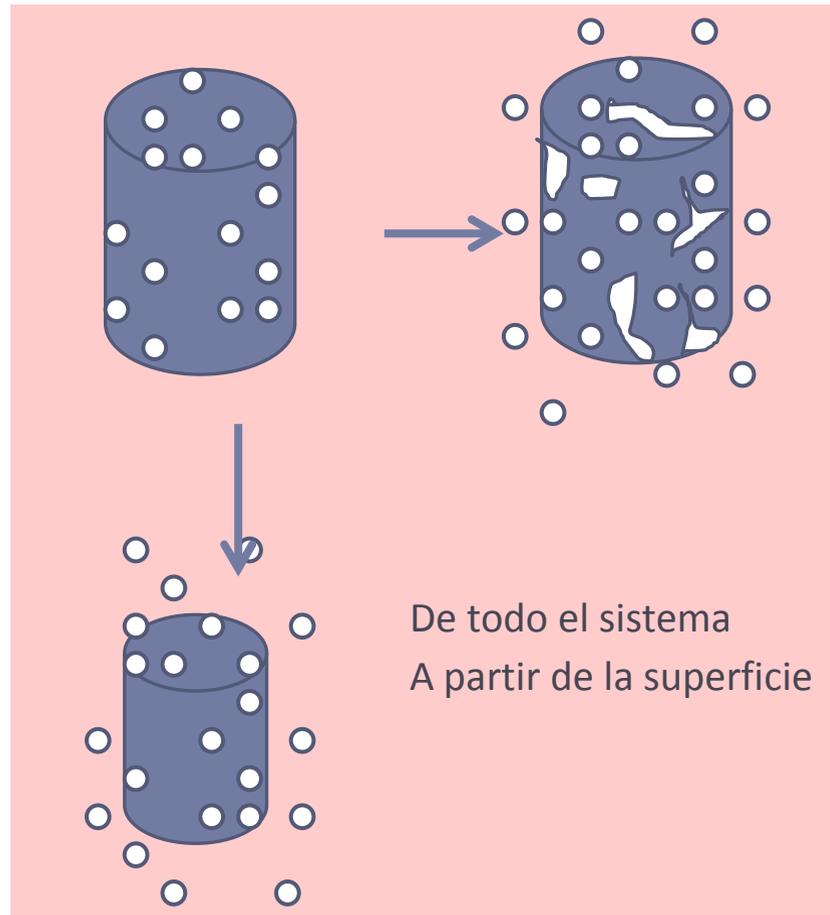
Difusión



Sistema matricial

**A.- Sistema reservorio
B.- Sistema matricial**

Erosión



Son dispersiones moleculares o particulares uniformes del p.a. en un sistema polimérico que resiste a la disgregación y regula la liberación.

HIDRÓFILAS

LIPÓFILAS

INERTES

MECANISMOS LIBERACIÓN PA:

DIFUSIÓN Y EROSIÓN

Derivados celulósicos: HPMC, NaCMC, ...

VENTAJAS

1. Procedimiento de elaboración
2. Bajas proporciones de excipientes
3. No riesgo liberación brusca
4. Bioerosionables



Compuestos de tipo graso: mono, di o triglicéridos, ácidos grasos, ceras y glicéridos mixtos de origen sintético.

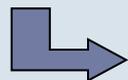
PREPARACIÓN

Adición de una solución o dispersión del P.a y aditivos



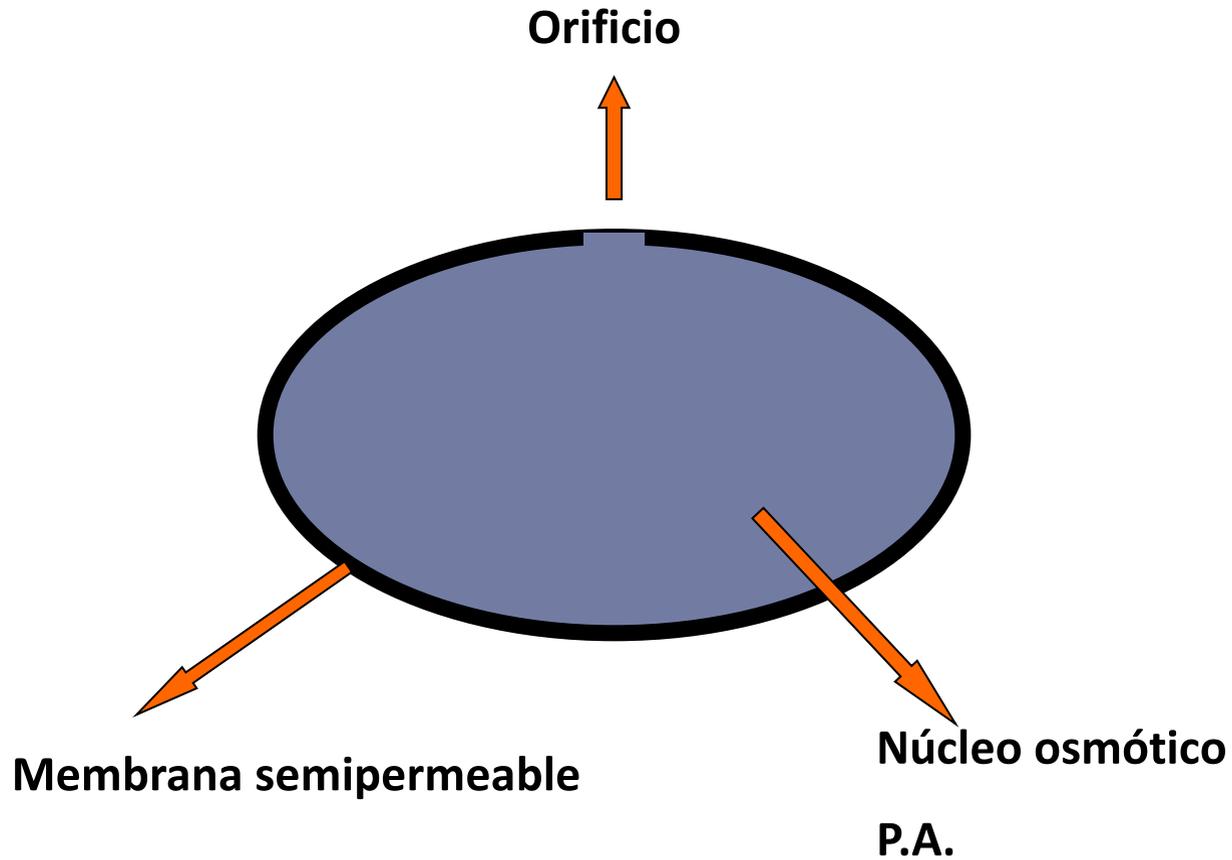
Grasa fundida → Evaporación solvente

Adición del P.a y aditivos

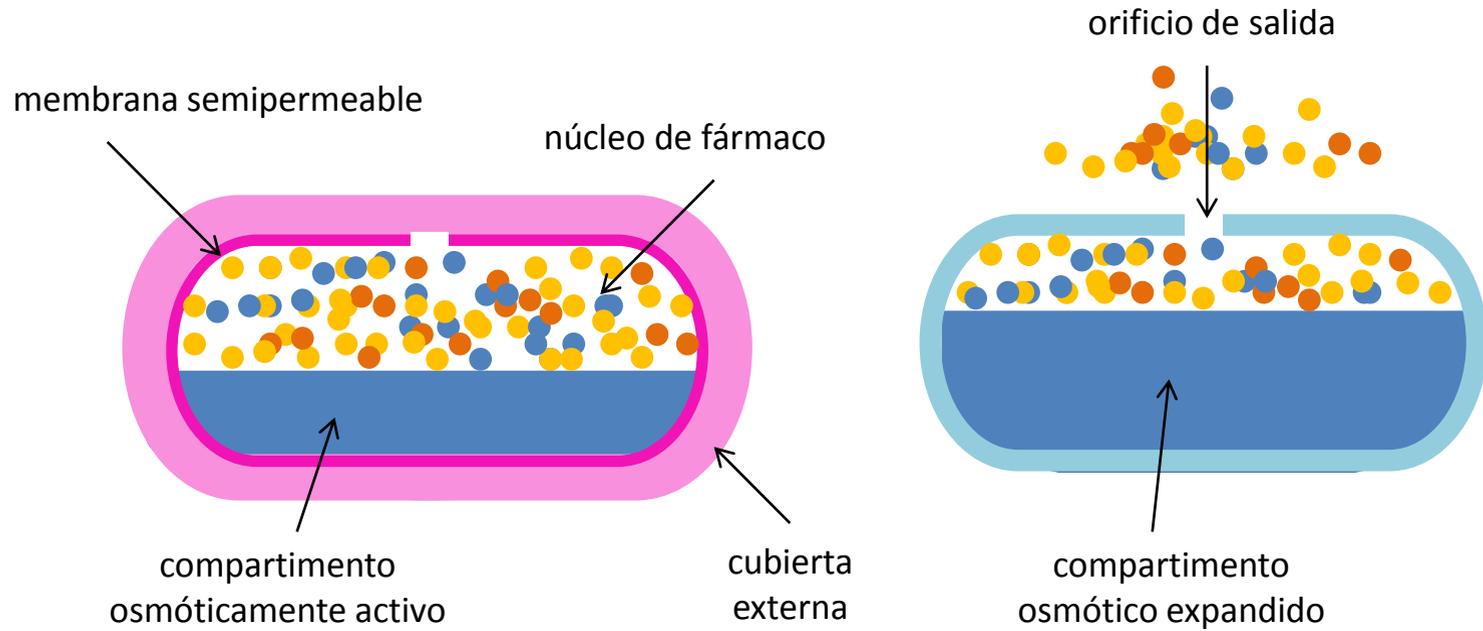


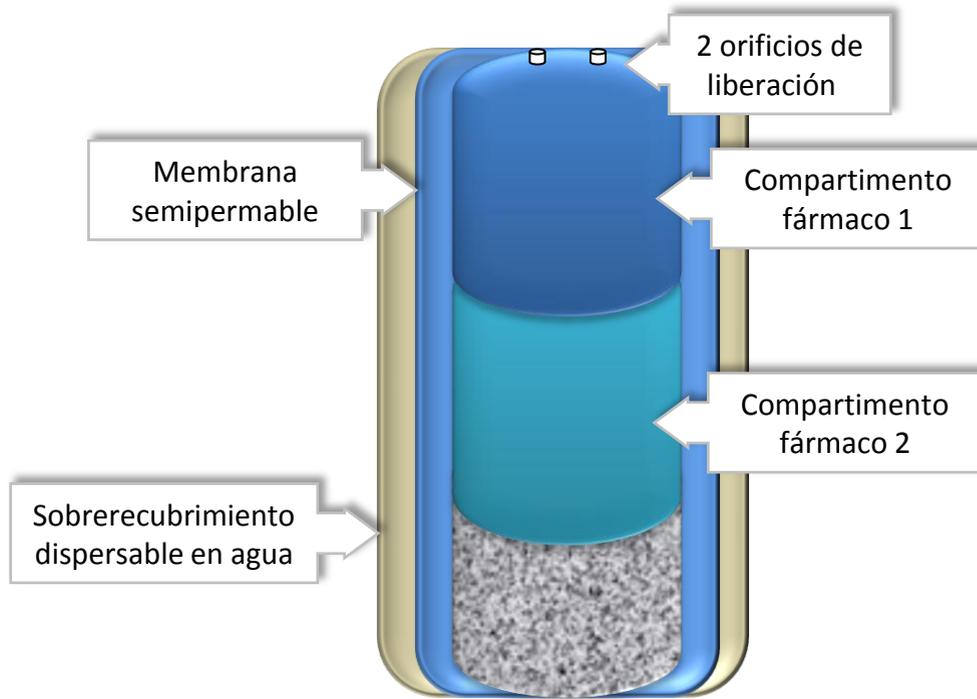
Grasa fundida

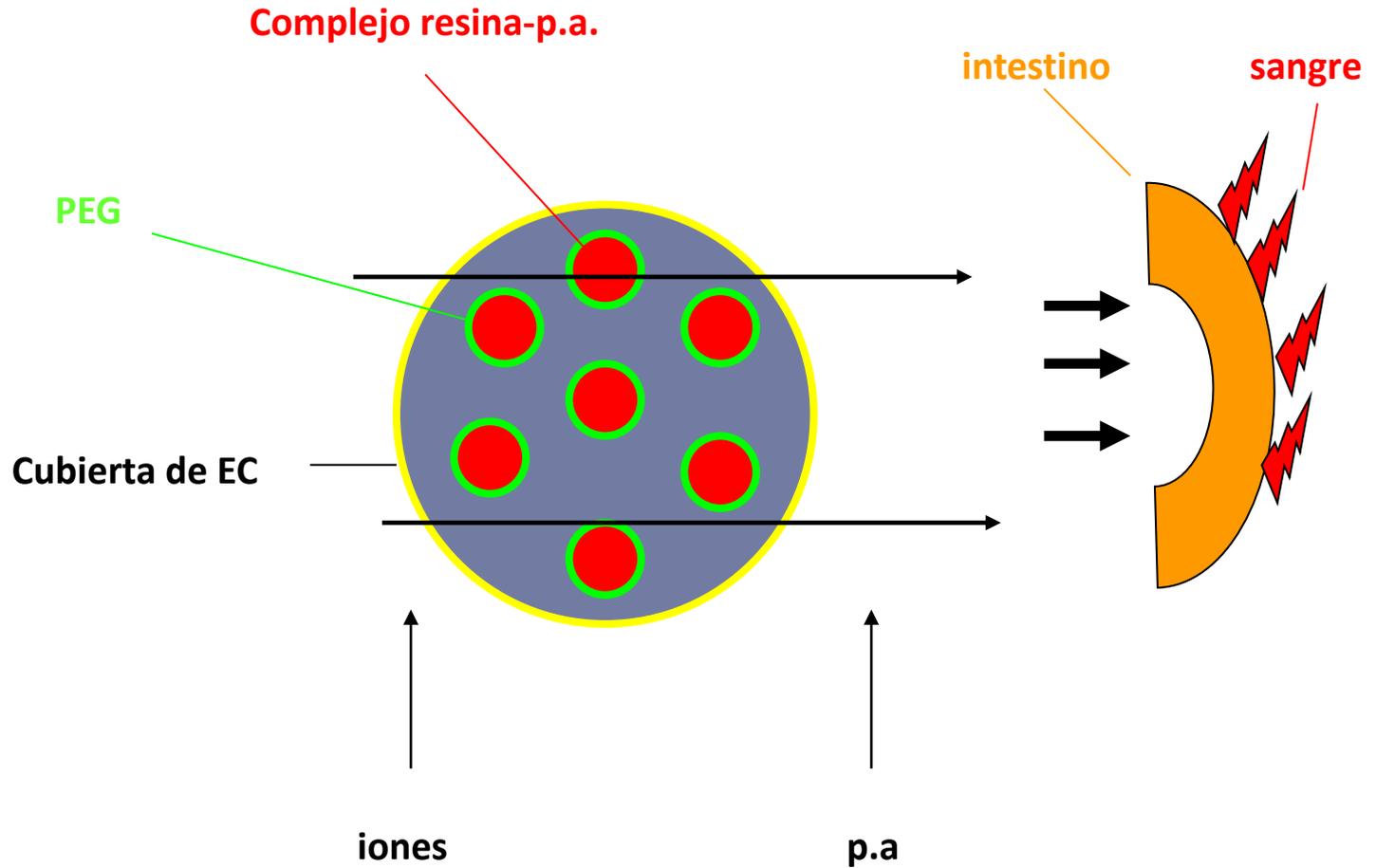
Están constituidas por materiales de origen orgánico o inorgánico insolubles, como el fosfato cálcico, sulfato cálcico, cloruro o acetato de polivinilo.



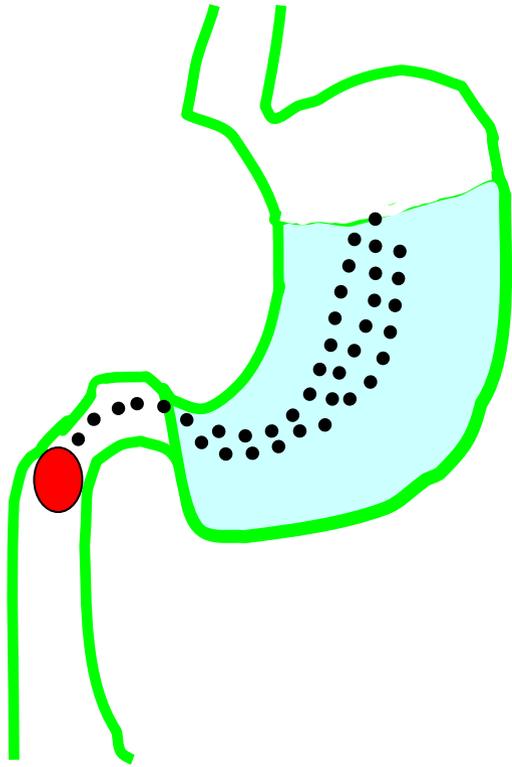
pH y velocidad de agitación



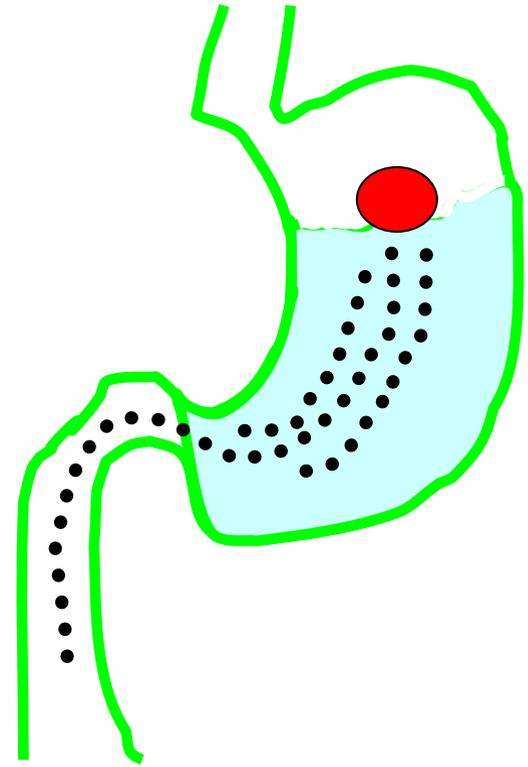




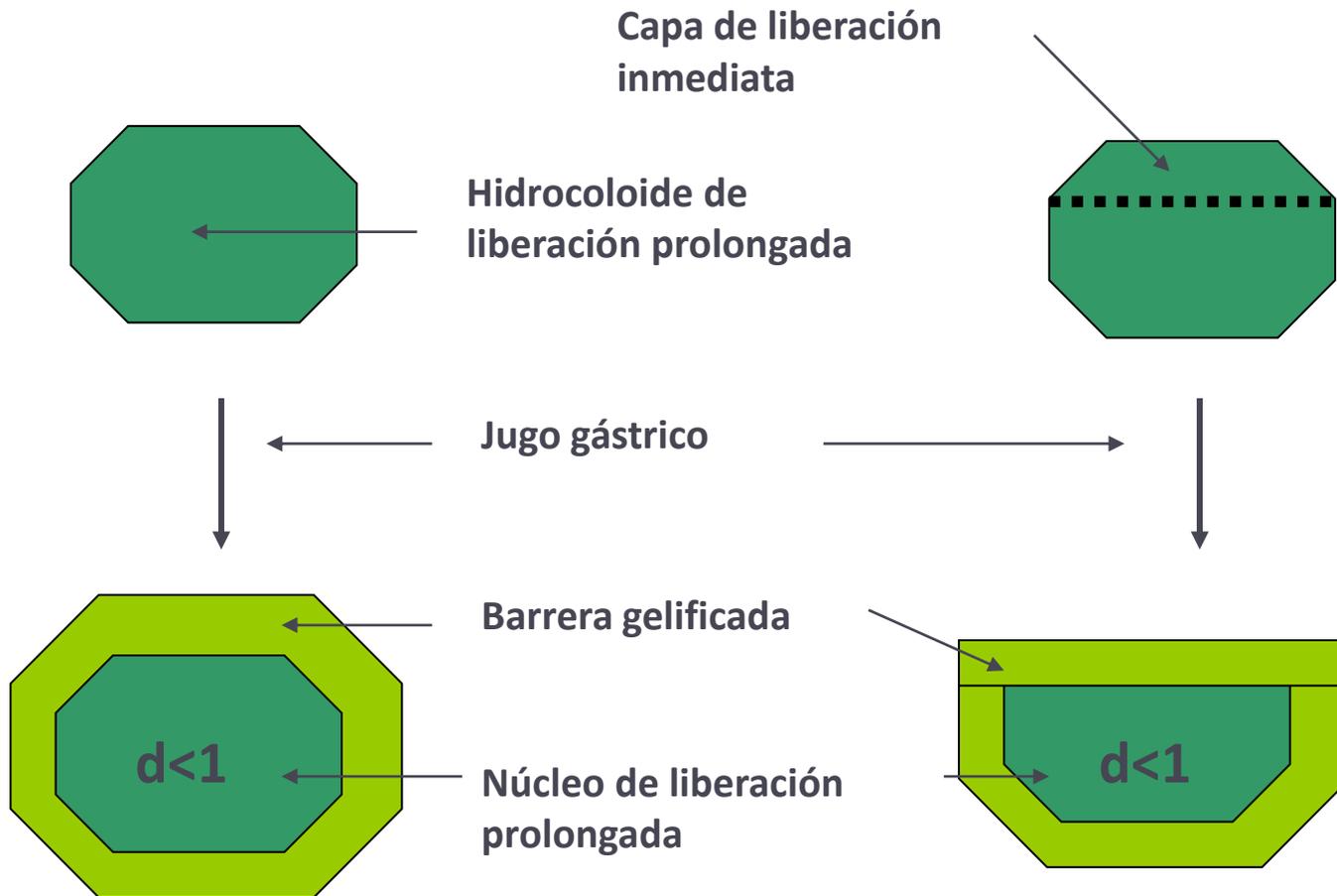
Intercambio iónico y difusión a través de membranas

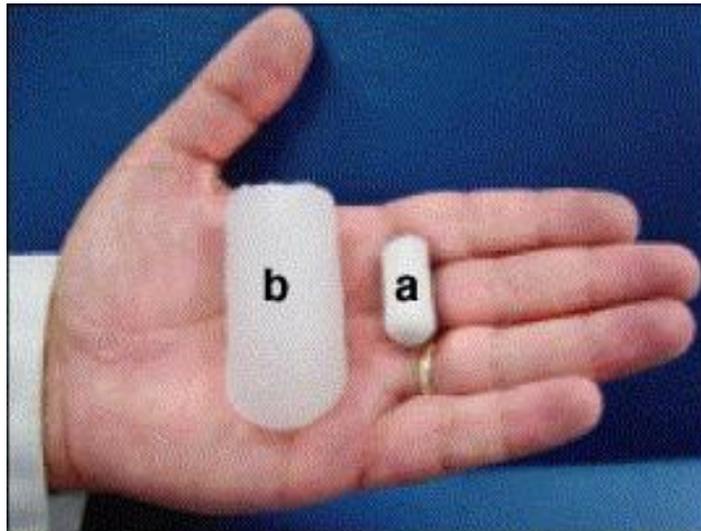


Comprimido convencional

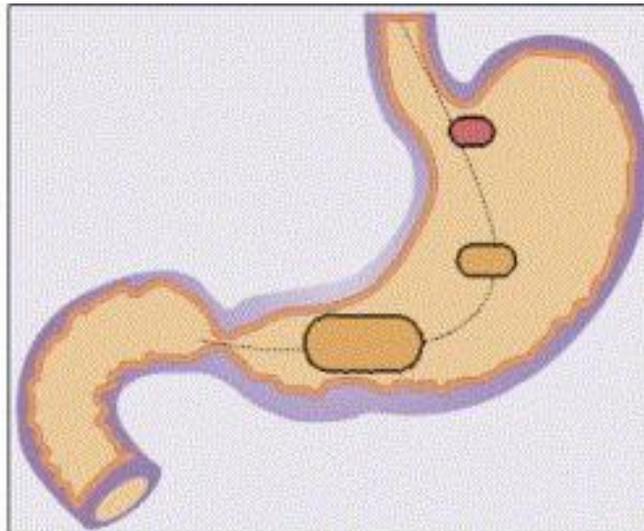


Sistema flotante





Hidrogel superporoso:
(a) en seco (b) hidratado,



Vaciamiento gástrico del sistema

