

UNIVERSIDAD:

UDS

MATERIA:

COSMETOLOGÍA III

TEMA:

INVESTIGACIÓN EXCIPIENTES

CATEDRATICO:

LIC. LILIA DEL CARMEN MORENO MOLINA

CUATRIMESTRE: 6to

ALUMNA:

SIRLEY CRUZ GORDILLO

LUGAR:

VILLAFLORES, CHIAPAS

FECHA: 26 / 06 / 2020

## **CARACTERISTICAS GENERALES DE LOS EXCIPIENTES**

Los excipientes se utilizan para convertir un fármaco en una forma farmacéutica que el paciente puede utilizar para tener un beneficio terapéutico. Los excipientes se incluyen en una formulación por poseer propiedades que en conjunto con un proceso permiten fabricar un medicamento con las especificaciones requeridas.

El mercado mundial de los excipientes se considera que se desarrolla en dos partes, por un lado, los mercados con un desarrollo moderado en los Estados Unidos y en Europa y un fuerte potencial de crecimiento en los mercados emergentes. Por otro lado, considerando los productos, los fabricantes de excipientes se concentran en el desarrollo de productos con un mejor desempeño y en materiales con multifuncionalidad. Ambos tipos de mercados de los excipientes son diferentes, con desafíos particulares para los proveedores.

Son aditivos que se utilizan para transformar una sustancia farmacológicamente activa en una forma farmacéutica, por lo tanto, pueden influir en las características químicas y/o físicas del principio activo.

En general, las sustancias activas por sí mismas no pueden ser fácilmente absorbidas por el cuerpo humano; necesitan ser administradas en la forma apropiada, por lo tanto, debe de ser disuelta o mezclada con una sustancia excipiente, si es sólido o blando; o un vehículo si es líquido. Dependiendo de la vía de administración, pueden ser usados distintos excipientes. Además, cuando un ingrediente activo ha sido purificado, muchas veces no puede permanecer así por mucho tiempo; otro uso de los excipientes es como estabilizadores que aseguran la activación del ingrediente activo lo suficiente como para hacer el producto competitivo.

Uso casi limitado a tabletas masticables

- Líquidos aceitosos que se pueden incorporar a la solución aglutinante, o en seco.
- Sacarina, aspartame y en algunos casos la sacarosa
- Otros: azúcar compresible, sucralosa, acesulfame potásico, inulina, maltitol y fructosa

## FORMAS FISIOQUIMICAS

### Excipientes DILUYENTES

Sirven para ajustar el peso de las tabletas, conseguir una masa adecuada para comprimir, preferentemente deben ser hidrófilos. Ejemplo: almidón, lactosa, dextrosa, sacarosa, manitol, sorbitol, glucosa, celulosa microcristalina (AVICEL), fosfato di básico y tribásico de calcio, sulfato de calcio, caolín y cloruro de sodio

### EJEMPLO:

Lactosa monohidratada a. Nombre USPNF: Lactosa Monohidratada

Sinónimos Tablettose; Lactochem; Microtose,

Nombre químico O-β-D-Galactopyranosyl-(1→4)-α-D-glucopyranose anhydrous

Fórmula empírica y peso molecular C<sub>12</sub>H<sub>22</sub>O<sub>11</sub>H<sub>2</sub>O 360.31

Categoría funcional Diluyente para tabletas comprimidas y cápsulas

### EXCIPIENTES AGLUTINANTES

Son materiales cohesivos capaces de ligar partículas de polvo y formar gránulos, con un contenido mínimo de finos, logrando así producir tabletas con buena dureza y baja friabilidad. Uso del 1 al 5 % en polvo Uso del 10 al 20% en solución. Gelatina, goma acacia, goma tragacanto, pectina, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, hidroxipropilcelulosa, etilcelulosa, almidones de maíz, papa y arroz; PVP, alginato de sodio y PEG 4000 o 6000.

### EXCIPIENTES DESINTEGRANTES

Facilitan la desintegración o disgregación de la tableta en agua o en jugo gástrico. Liberan al fármaco de la tableta, aumentando la porosidad. Incorporar en la fase externa o interna-externa. Uso del 1 al 15% Almidón (maíz / papa) celulosas microcristalina, crospovidona, croscaramelosa sódica, metilcelulosa, carboximetilcelulosa sódica, hidroxipropilmetil celulosa, ácido algínico, alginato de sodio.

## EXCIPIENTES LUBRICANTES

Reducen la fricción en la etapa de compresión entre las partículas en la masa del polvo, polvo – punzones, tableta-matriz o punzones-matriz. Deslizantes: Flujo gránulo-gránulo, flujo tolva-matriz. Ej.: Dióxido de silicio, almidón de maíz, celulosa microcristalina, talco, estearatos de magnesio, calcio o zinc

Lubricantes. Reducen fricción metal – metal entre punzones – matriz, matriz – tableta. Ej.: Estearato de magnesio, ácido estéarico, talco, polietilenglicoles, acetato y benzoato de sodio. .-

Antiadherentes. Disminuyen fricción metal – tableta evitando que la tableta se adhiera a la matriz o a los punzones. Ej.: talco, celulosa microcristalina, almidón de maíz y estearato de magnesio.

## EXCIPIENTES ABSORVENTES

Captan por adsorción componentes líquidos o humedad.

Almidones, para captar aceites

Dióxido de silicio coloidal, para captar agua y aceites

Celulosa microcristalina, para captar aceites agua y pasta

Fosfato de calcio tribásico para captar aceites y pastas.

## EXCIPIENTES HUMIDIFICANTES

Evitan un secado excesivo del granulado

Glicerina o almidón de 1 al 3% incorporada al líquido de la granulación.

## EXCIPIENTES COLORANTES

Eliminan colores desagradables.

Identifican productos

Mejoran la elegancia de los productos.

FD&C y D&C.

Se incorporan en el líquido granulante o en el polvo premezclado (Directa)

Se usan al 0.5%

## EXCIPIENTES SABORIZANTES Y ADULCORANTES

Uso casi limitado a tabletas masticables

Líquidos aceitosos que se pueden incorporar a la solución aglutinante, o en seco.

Sacarina, aspartame y en algunos casos la sacarosa

Otros: azúcar compresible, sucralosa, acesulfame potásico, inulina, maltitol y fructosa.

## EXCIPIENTES COPROCESADOS

Ingeniería de partículas como fuentes de nuevos materiales.

El desarrollo de materiales co-procesados está basado en la interacción de dos o más materiales a nivel de partículas con el objetivo de lograr un sinergismo en la funcionalidad.

Propiedades necesarias:

Fluidez, compactibilidad, baja sensibilidad al lubricante.

## FUNCIONES DEL EXCIPIENTE

Uso casi limitado a tabletas masticables

- Líquidos aceitosos que se pueden incorporar a la solución aglutinante, o en seco.
- Sacarina, aspartame y en algunos casos la sacarosa
- Otros: azúcar compresible, sucralosa, acesulfame potásico, inulina, maltitol y fructosa

## EXCIPIENTES COMPUESTOS POR EMULSIONES DE AGUA

Interviene en casi todas las formas de dosificación.

Estable (en condiciones adecuadas) y fisiológico (tolerancia)

Características fisicoquímicas adecuadas para disolver sustancias iónicas y polares: elevada constante dieléctrica, elevado momento dipolar y carácter anfiprótico

Aplicaciones: vehículo en un gran número de preparados, líquido de lavado de maquinaria y de envases, medio de transferencia térmica (vapor, refrigeración.)

## POMADAS

CREMAS REFRESCANTES: emulsiones lábiles que ceden el agua con facilidad cuando se aplican sobre la superficie de la piel.

AGUA PARA INYECTABLES: agua estéril, agua pi a granel.

## **EXCIPIENTES COMPUESTOS POR EMULSIONES DE ACEITE**

### GLICERIDOS SEMISINTÉTICOS O SINTÉTICOS:

Miristato de isopropilo

Oleato de dodecilo

Palmitato de isopropilo

Oleato de etilo

### VASELINA Y DERIVADOS: -

Obtención a partir de determinadas fracciones del petróleo –

Estables, inertes y compatibles con la piel

Extensibilidad variable - Difícil eliminación y manchan la ropa

Alta oclusividad: a veces se utiliza sola para mantener una textura suave de la piel y favorecer el correcto desarrollo y formación del estrato córneo, Ejemplos: ACEITE DE VASELINA O PARAFINA LÍQUIDA; VASELINA BLANCA O FILANTE

### SILICONAS:

Polímeros sintéticos (polisiloxano): hidrofobia, inocuidad, adherencia y estabilidad –

Adicionadas con otros excipientes: adherencia y oclusividad -, Ejemplos: DIMETICONAS,

FENILDIMETICONAS, CICLOSILICONAS.

EMULSIONES SILICÓNICAS (A/S):

Fabricación en frío

Color blanco brillante, excelente extensibilidad, ausencia de residuos de producto

La fase acuosa debe tener pH entre 4 y 7.5 para que no disminuya la viscosidad  
Incompatibilidades: óxidos y sales de Zn, Al, Fe, etc., emulgentes de alto HLB.

Las emulsiones A/S se usan como base para múltiples productos como maquillajes, cremas hidratantes, cremas nutritivas, lociones limpiadoras, coloretes, antitranspirantes en barra, aplicadores de bola, filtros solares, etc...

ACEITES HIDROGENADOS:

Aceites vegetales sometidos a un proceso de hidrogenación que destruye los dobles enlaces y proporciona mayor consistencia y estabilidad al aceite

Se liberan monooleinas que actúan como emulgentes A/O

Ejemplo: aceite de cacahuete hidrogenado

## **SUSPENSIONES**

Una suspensión se define como un sistema disperso compuesto por dos fases, las cuales contienen él o los fármacos y aditivos. Una de las fases, dispersa o interna está constituida por sólidos (fármacos) insolubles que solo se dispersan en la fase externa.

Las suspensiones pueden ser usadas farmacéuticamente por algunas de las siguientes razones:

- Muchas personas tienen dificultades para deglutir las formas farmacéuticas posológicas sólidas, y por lo tanto requieren que el fármaco se disperse en un líquido.
- El sabor de la mayoría de los fármacos es más apreciable si se encuentra en solución y no en su forma insoluble.
- En las suspensiones orales el medicamento se entrega en forma finamente dividida, por lo tanto, la disolución se produce inmediatamente en los líquidos gastrointestinales.

- Formas insolubles de medicamentos pueden prolongar la acción de un fármaco mediante la prevención de la degradación rápida de este en presencia de agua.
- Cuando el fármaco es inestable en contacto con el vehículo, las suspensiones se resuspenden antes de la administración al paciente con el fin de reducir la cantidad de tiempo que las partículas del fármaco están en contacto con el medio de dispersión.
- Fármacos que se degradan en solución acuosa pueden suspenderse en una fase no acuosa.
- Voluminosos, polvos insolubles pueden formularse como una suspensión para que sean fáciles de tomar.

Todas las suspensiones están conformadas por fase dispersa, que es la fase sólida, fase dispersante que es la fase líquida, también llamada continua o externa.

Además, suelen contener tensos activos, que son agentes dispersantes cuyo rol es impedir que los sólidos se aglutinen o sedimenten.

A diferencia de las soluciones, las suspensiones no son mezclas homogéneas y son inestables, ya que las partículas insolubles tienden a separarse del líquido en el que están dispersas con el paso del tiempo. Existen varios fenómenos que intervienen en la separación de la fase dispersa y el dispersante:

1. Flotación: las partículas de soluto forman pequeños aglomerados que flotan en el líquido dispersante. En este caso se puede subsanar añadiendo humectantes polioxietilenados.
2. Floculación: se forman pequeños aglomerados grumosos en el seno del líquido dispersante. Se puede solucionar con la adición de humectantes y en ocasiones electrolitos que favorecen la repulsión de las partículas, evitando que se aglomeren.
3. Cristalización: las partículas de soluto se agregan formando grandes cristales. Para evitarlo se pueden añadir viscosizantes.
4. Sedimentación: se forma un sedimento, en ocasiones muy rápidamente a pesar de la agitación. También puede controlarse mediante el uso de viscosizantes.
5. Formación de tortas (caking): el sedimento que aparece es compacto y difícil de dispersar a no ser que se realice una agitación enérgica. Se pueden impedir incorporando humectantes y viscosizantes. Estos procesos comprometen la homogeneidad de las

suspensiones, prácticamente desde el momento de su formación, por lo que en todas ellas es fundamental indicar claramente en la etiqueta: “agítese antes de usarla”. Un recuso útil para retrasar la aparición de estos fenómenos y aumentar la estabilidad de las suspensiones es disminuir el tamaño de la partícula, mediante una pulverización previa del sólido a dispersar y/o emplear viscosizantes o excipientes con función humectante. Los viscosizantes o suspensores incrementan la viscosidad dificultando así la agregación de las partículas de los principios activos insolubles sedimenten. Los más empleados son carboximetilcelulosa sódica, polietilenglicoles de alto peso molecular, metilcelulosa y goma Xanthan. Los humectantes actúan aumentando la superficie específica entre los principios activos insolubles y el medio dispersante. Los más utilizados son glicerina, propilenglicol, polietilenglicoles líquidos de bajo peso molecular y derivados polioxietilenados de sorbitan: Polisorbatos (Tweed®) o de aceite de ricino hidrogenado (Cremophor® RH 40)

#### **MATERIAS PRIMAS PARA EXCIPIENTE:**

Comúnmente se utilizan almidones, azúcares y celulosas como hidroxipropil celulosa o hidroxipropil metil celulosa.

También se utilizan azúcares como xilitol, sorbitol o maltitol.

#### **BIBLIOGRAFIA**

- Villafuerte Robles, Leopoldo, *Los excipientes y su funcionalidad en productos farmacéuticos sólidos* Revista Mexicana de Ciencias Farmacéuticas, 2011.
- Otto Raúl Torres Wohlers, *desarrollo experimental de un excipiente para la fabricación de productos farmacéuticos sólidos*, marzo 2011.