



LOLLIMAX

PASTILHAS BUCAIS E PIRULITOS

Base pronta para preparação de pastilhas bucais e pirulitos

LOLLIMAX é uma mistura de ingredientes específicos para formação de uma base anidra estável, de desintegração lenta, ideal para a preparação de pastilhas bucais e pirulitos, que auxilia a absorção de ingredientes ativos através da mucosa oral e/ou sublingual.

A região bucal da cavidade oral é um alvo atrativo para administração de determinados fármacos. A mucosa oral é muitas vezes mais permeável que a pele, o que favorece e agiliza os efeitos desejados dos ativos ali veiculados, já que por sua alta permeabilidade, atinge rapidamente a corrente sanguínea.

A absorção de medicamento via membranas mucosas da cavidade oral pode ocorrer tanto pela via sublingual, via bucal ou em regiões locais por difusão passiva, principalmente.

Sublingual > Bucal > Palatal

As pastilhas dissolvem-se lentamente na boca e os ingredientes ativos dissolvidos podem ser potencialmente absorvidos através da mucosa oral, onde vasos sanguíneos podem carregá-los para o resto do organismo. De fato, o ingrediente ativo liberado na boca pela pastilha pode ser absorvido tanto pela mucosa bucal e sublingual, como também pode ser parcialmente deglutido com a saliva e direcionado ao trato gastrointestinal. Cerca de 50 a 70% da dose veiculada pode ser deglutida com a saliva e o restante será absorvido através da mucosa bucal (30-50%).

Apresenta-se como um pó branco e levemente bege, com odor muito suave de baunilha, disponível em duas versões: **com** edulcorantes e **sem** edulcorantes.

Diferenciais

- Produto livre de glúten
- Produto livre de lactose
- Produto livre de lácteos
- Produto livre de parabenos
- Produto livre de sacarose
- Produto livre de gorduras trans

BENEFÍCIOS:

- Aumenta a solubilidade aquosa ou as características de dissolução de compostos pouco solúveis;
- Contribui para o aumento da biodisponibilidade de ativos veiculados;
- Eficiente no mascaramento do sabor amargo, promovido por certos ingredientes ativos (ex. trans-resveratrol, testosterona, etc);
- Apresenta estabilidade química e microbiológica;
- Não sofre hidrólise ou deterioração com o tempo de armazenamento e não favorece o crescimento de fungos;
- Apresenta menor higroscopia e maior estabilidade térmica em relação a outras bases preparadas com polietilenoglicóis, sendo ideal para as condições ambientais em regiões tropicais.

Indicações de uso:

- Base pronta para preparação de pastilhas bucais e pirulitos.



Algumas classes terapêuticas de ingredientes ativos que podem, potencialmente, ser veiculados nesta forma farmacêutica:

Classe terapêutica	Exemplos de ingredientes ativos
Agente para tratamento da disfunção sexual erétil	Sildenafil citrato
Agente sialogogo	Pilocarpina HCl
Antialérgicos	Cetirizina HCl
Antiemético	Metoclopramina HCl
Antifúngicos	Miconazol, clotrimazol, nistatina
Estimulante do apetite	Ciproheptadina HCl
Hormônios esteroidais	Progesterona, estradiol, testosterona, oxandrolona
Nutracêuticos	<i>trans</i> -resveratrol, Pinnus pinaster, , curcumina, crisina, quercetina, coenzima Q10

Recomendação de uso:

Uso transmucoso oral, pode ser usado puro ou como veículo com inclusão de ingredientes ativos.

Informações adicionais:

Efeitos Adversos: irritação na mucosa oral em pessoas sensíveis.

Contraindicações / Precauções: evitar uso em pacientes alérgicos ou sensíveis a qualquer componente deste produto.

Composição:

Lollimax com edulcorantes: Polietilenoglicol, Goma xantana, sílica coloidal, lecitina, neohesperidina dihidrocalcona, sucralose, Acessulfame K, ácido cítrico, flavorizante de baunilha.

Lollimax sem edulcorantes: PEG 6000, PEG 4000, Goma Xantana, Ácido Cítrico, Lecitina de Soja Pó, Dióxido de Silício Coloidal e flavorizante de baunilha.

FARMACOTÉCNICA

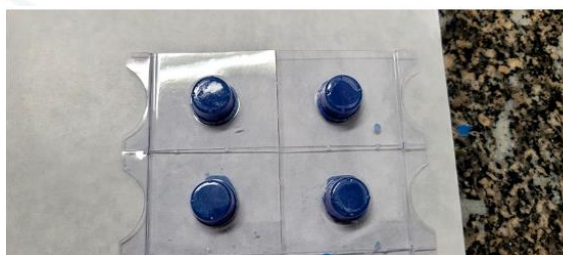
Estabilidade (produto final): de modo geral, a pastilha preparada com Lollimax é considerada anidra e desta forma resulta em uma forma farmacêutica estável, desde que protegida da umidade e do calor.

pH Estabilidade (produto final): não aplicável.

Solubilidade: pouco solúvel em água.

Orientações:

Lollimax é preparado na farmácia por moldagem em formas ou moldes apropriados da base previamente fundida e aditivada de ingredientes ativos e excipientes. Moldes de diferentes formatos, tamanhos e materiais (plástico, silicone e aço inoxidável) podem ser empregados na obtenção das pastilhas e pirulitos conforme exemplos a seguir:

**Procedimento de preparo (moldagem com aquecimento)**

Requisitos prévios:

1. Determinar o peso médio das pastilhas bucais ou pirulitos preparados somente com Lollimax
2. Conforme o procedimento de preparo de pastilhas ou pirulitos inertes, determinar a quantidade de base a ser utilizada;
3. Determinar as quantidades de ativos;
4. Determinar a quantidade de flavorizante.

Procedimento de preparo de Pastilhas bucais ou Pirulitos contendo ingrediente ativo:

Fórmula base para pastilha transmucosa oral ou pirulito com Lollimax

Ingrediente (s) ativo (s) X mg
 Flavorizante (grau alimentício) 0,5-1 %
 Corante hidrossolúvel (grau alimentício) qs
 Lollimax qsp 1 dose.

1. Separar todos os ingredientes necessários para o preparo da formulação;
2. Preparar uma quantidade excedente ao solicitado pela prescrição para compensar eventuais perdas.

Considerar para fins de cálculo e pesagem uma quantidade excedente de ingrediente ativo e base Lollimax suficiente para o preparo adicional de cerca de 10% da quantidade de unidades de pastilhas ou pirulitos solicitados;

3. Pesar separadamente a quantidade necessária de Lollimax, conforme cálculo anteriormente realizado. Pesar/medir com precisão os demais ingredientes a serem aditivados;

4. Triturar, tamisar (em tamis malha 40 *mesh*) e misturar geometricamente os ingredientes sólidos (somente os ingredientes que serão aditivados) em um gral com pistilo;



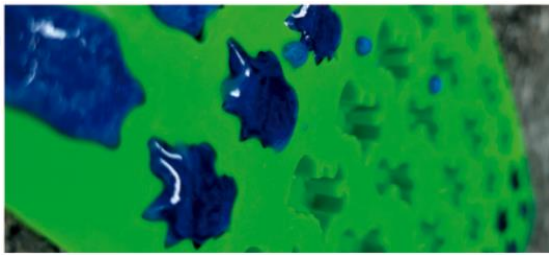
5. Verter Lollimax, previamente pesado, em um béquer e aquecer aproximadamente a 60°C em uma placa de aquecimento ou banho-maria, sob leve agitação. Adicionar quantidade suficiente da solução de corante desejado (usar preferencialmente uma solução alcoólica do corante).



6. Deixar esfriar, sob agitação suave, até atingir a temperatura de 55°C.

7. Polvilhar os ingredientes pulverizados do passo 4 aos poucos sobre o passo 6, desagregando-os com o auxílio de um pequeno tamis e sob agitação moderada até dispersão uniforme. Evitar a incorporação de ar durante a agitação.

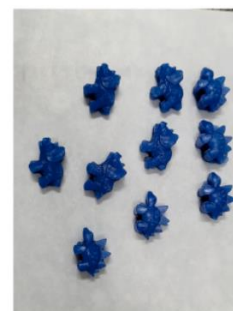
8. Verter rapidamente a mistura fundida para o molde, permitindo um excesso para que transborde um pouco das cavidades. A quantidade excedente é necessária para compensar a perda decorrente da retração que ocorre com o resfriamento.



9. Após completo o resfriamento e solidificação das pastilhas ou pirulitos, nivele retirando o excesso com uma espátula previamente aquecida na placa de aquecimento.



10. Desenformar as pastilhas ou pirulitos, caso os tenha preparado em moldes reutilizáveis. Não desenformar no caso de utilização de molde dispensável, pois será realizada pelo próprio paciente.



Capacidade de Incorporação de Ingredientes Farmacêuticos (para veículos):

Suporta a carga de 30% de ativos para cada pastilha.

Incompatibilidades:

Pode reduzir a atividade antibacteriana da penicilina e bacitracina; é incompatível com sorbitol, fenol e alguns corantes; pode interagir com sulfonamidas, promovendo alteração de cor.

Ingredientes ativos que fundem ou degradam abaixo de 50°C.

Conservação:

Acondicionar em recipientes herméticos, ao abrigo da luz, calor e umidade. Temperatura ambiente.

Cabe também avaliação farmacêutica conforme a formulação, sistema conservante e condições do produto.

Referências Bibliográficas

1. WALLE T., et al. High Absorption But Very Low Bioavailability of Oral Resveratrol in Humans. Drug Metabolism and Disposition 32:1377-1382, 2004.
2. ASENSI M. et al. Inhibition of cancer growth by resveratrol is related to its low bioavailability. Free Radical Biology & Medicine, Vol. 33, No. 3, pp. 387-398, 2002.
3. PURATCHIKODY, A. et al. Buccal Drug Delivery: Past, Present and Future - A Review. International Journal of Drug Delivery 3 (2011) 171-174.
4. BOBADE, N.N. et al. A Review on Buccal Drug Delivery System. International Journal of Pharmacy and Pharmaceutical Science Research 2013; 3(1): 35-40.
5. Int J Pharm Comp., 4,414-420,2000.
6. WREN B.G., DAY R.O., McLACHIAN A.J., WILLIAMS K.M. Pharmacokinetics of estradiol, progesterone, testosterone and dehydroepiandrosterone after transbuccal administration to postmenopausal women. Climacteric. 2003 Jun;6(2): 104-11.

7. LATHEESHJAL L. et al. Formulation and Development of Buccal Drug Delivery System containing Curcumin. International Journal of PharmTech Research, Vol. 3, No.1, pp 37-41, 2011.
8. The United States Pharmacopeial Convention. USP Pharmacists' Pharmacopeia. 2nd ed. Rockville: The United States Pharmacopeial Convention, 2008. p.1108-111.
9. ALLEN L.V.Jr. Sildenafil Citrate 25-mg Sublingual Troches. International Journal of Pharmaceutical Compounding. 3(2); 1999:135.
10. ALLEN L.V.Jr. Bioidentical Testosterone Replacement Therapy. US Pharmacist. 30(8); 2005:64-65.
11. WALLE T. et al. Disposition and metabolism of the flavonoid chrysin in normal volunteers. Science Ltd Br J Clin Pharmacol, 51 (2001), 143-146.