

Compositions of Pharmaceutical Dosage Forms

*W Netisingha
Sem 1/63*

Pharmaceutical Dosage Forms

Medicines = API + Pharmaceutical Excipients

- Pharmaceutical Excipients
- Pharmaceutical Additives
- Pharmaceutical Aids
- Pharmaceutical Adjuncts
- Pharmaceutical Adjuvants
- Pharmaceutical Necessities

Pharmaceutical Excipients

สารปรุงแต่งยา หรือ สารช่วยในยาเตรียม คือ

สารที่ไม่ให้ผลในการรักษา ใช้เป็นสารช่วยทางเภสัชกรรมในการเตรียมเภสัชภัณฑ์รูปแบบต่าง ๆ

USP Definition:

Excipients are often referred to as “inactive ingredients” because, in drugs, they comprise of everything except the active pharmaceutical ingredients (APIs).

Excipient functions range from helping to guarantee the stability and bioavailability of the API to the drug product’s manufacturability to its texture and taste. Excipients are a major component of almost all drugs, as well as foods, cosmetics and dietary supplements.

Pharmaceutical Excipients

Functions:

- Helping to guarantee the stability and bioavailability of the API,
- Helping the drug product's manufacturability,
- Giving the product's texture and taste.



Pharmaceutical Excipients

Ideal Properties:

- Inactive
- Non-toxic, Non-irritating, Non-sensitizing
- Compatible with the API and other ingredients

Classification of Dosage Forms

According to

Route of Administration	Physical Characteristics
1. Oral	1. Solid, nonsterile
2. Topical	2. Liquid, nonsterile
3. Rectal	3. Semisolid, nonsterile
4. Vaginal	4. Sterile products
5. Parenteral	5. Gaseous
6. Ophthalmic	6. Radiopharmaceuticals
7. Otic	
8. Inhaled	

Solid Dosage Forms

Examples:

- Powders and granules



- Tablets
- Capsules



Excipients used in Solid Dosage Forms

Powders, Granules, Tablets and Hard capsules:

- *Diluents (ตัวทำเจือจาง) or fillers (สารเพิ่มปริมาณ)*
increase the bulk of solid unit dosage form eg.
starch, lactose, dextrose, microcrystalline cellulose
- *Lubricants (สารหล่อลื่น)*
prevent clumping and sticking of the ingredients
to the machine eg. Talcum, magnesium stearate.

Excipients used in Solid Dosage Forms

- *Binders or adhesives (สารยึดเกาะ)*
hold the ingredients together ensuring that granules and tablets can be formed with required mechanical strength eg. Gelatin, starch paste, povidone.
- *Flavors and colors (สารแต่งกลิ่นรส และสารแต่งสี)*
mask unpleasant taste and improve appearance
eg. Mint, cherry, vanilla.
- *Sweetening agent, sweeteners (สารแต่งรสหวาน)*
impart sweetness to the product eg. Saccharin, mannitol.

Excipients used in Solid Dosage Forms

- *Glidants (สารช่วยไหล)*
improve powder flow characteristics eg.
Fumed silica, talcum, starch.
- *Disintegrants (สารช่วยแตกตัว)*
facilitate breakup or disintegration of tablets after
administration eg. Starch, clays, cellulose, veegum.

Excipients used in Solid Dosage Forms

- *Wetting agents (สารช่วยเปียก)*
improve water penetration eg. Sod. Laurylsulfate, tweens, pluronics.
- *Coating materials (สารเคลือบ)*
protect tablet ingredients from deterioration by moisture, masking unpleasant taste and smell, impart pleasant appearance.

Excipients used in Solid Dosage Forms

Soft Capsules:



- *Diluents (ตัวทำเจือจาง) or fillers (สารเพิ่มปริมาณ)*
eg. Mineral oil, vegetable oil

Excipients used in Solid Dosage Forms

Soft Capsules: (cont.)

- *Solvent (ตัวทำละลาย)*
dissolve the API eg. Soybean oil, polyethylene glycols (PEGs).
- *Solubilizing agents (สารช่วยละลาย)*
dissolve the API eg. Surfactants (polysorbate).
- *Suspending agents (สารช่วยแขวนตะกอน)*
suspend the API eg. Soybean oil+beeswax, PEGs

Liquid Dosage Forms

- Solutions (ยาน้ำใส)



- Suspensions (ยาน้ำแขวนตะกอน)

- Emulsions (ยาน้ำอิมัลชัน)



Excipients used in Liquid Dosage Forms

Solutions (ยาน้ำใส)

- *Vehicles (น้ำกระสายยา, กระสายยา)*

A carrier or inert medium used as a solvent or diluent in which the medicinally active agent is formulated and or administered. (Dictionary of Pharmacy, 1986)

- *Solvents (ตัวทำละลาย) and Diluents*

dissolve the API and other ingredients eg.

Purified water (most common), ethanol, glycerol,

propylene glycol, low MW PEGs.

Excipients used in Liquid Dosage Forms

Solutions (ยาน้ำใส): cont.

- *Vehicles (น้ำกระสายยา, กระสายยา)*
 - *Other vehicles (กระสายยาอื่น ๆ)* eg.
Simple syrup, aromatic elixir.
- *Antioxidants (สารต้านออกซิเดชั่น)*

prevent or inhibit chemical degradation caused by oxidation eg. Sod.bisulfite, ascorbic acid, BHA, BHT, Sod. edetate.

Excipients used in Liquid Dosage Forms

Solutions (ยาน้ำใส): cont.

- *pH-adjusting agents* (สารปรับความเป็นกรดต่าง)
to maintain pH of the solution eg. Phosphate buffers, acetate buffers.
- *Flavors and colors* (สารแต่งกลิ่นรส และสารแต่งสี)
- *Sweetening agent, sweeteners* (สารแต่งรสหวาน)
- *Preservatives* (สารกันเสีย)
to prevent microbial growth in the solution eg.
benzalkonium chloride, sorbic acid, paraben.

Excipients used in Liquid Dosage Forms

Solutions (ยาน้ำใส): cont.

- *Thickening agents or viscosity-inducing agents*
(สารเพิ่มความหนืด)

to thicken or increase the viscosity of the solution eg.
acacia, methylcellulose, carbomer.

Excipients used in Liquid Dosage Forms

Suspensions (ยาน้ำแขวนตะกอน)

- *Vehicles* (น้ำกระสายยา, กระสายยา)
- *Antioxidants* (สารต้านออกซิเดชัน)
- *Buffers and pH-adjusting agents* (บัฟเฟอร์และสารปรับความเป็นกรดต่าง)
- *Flavors and colors* (สารแต่งกลิ่นรส และสารแต่งสี)
- *Sweetening agent, sweeteners* (สารแต่งรสหวาน)
- *Preservatives* (สารกันเสีย)

Excipients used in Liquid Dosage Forms

Suspensions (ยาน้ำแขวนตะกอน)

- *Suspending agents (สารช่วยแขวนตะกอน) and/or viscosity-inducing agents (สารเพิ่มความหนืด)*
- *Flocculating agents (สารช่วยจับกลุ่ม)*
prevent caking of the API eg. NaCl, Calcium chloride.

Excipients used in Liquid Dosage Forms

Emulsions (ยาน้ำอิมัลชัน)

- *Vehicles (น้ำกระสายยา, กระสายยา) = Oil + Water*
 - *Oil* eg. Mineral oil, vegetable oils, volatile oils.
 - *Water*
- *Emulsifiers or emulsifying agents (ตัวทำอิมัลชัน)*
prevent the coalescence of the dispersed droplets
eg. Acacia, Tragacanth, Sodium lauryl sulfate, Tweens.

Excipients used in Liquid Dosage Forms

Emulsions (ยาน้ำอิมัลชัน)

- *Antioxidants* (สารต้านออกซิเดชัน)
- *Flavors and colors* (สารแต่งกลิ่นรส และสารแต่งสี)
- *Sweetening agent, sweeteners* (สารแต่งรสหวาน)
- *Preservatives* (สารกันเสีย)

Semisolid Dosage Forms

Ointments (ยาขี้ผึ้ง)



Creams (ครีม)



Gels (เจล)



Pastes (ยาเพสท์)



Excipients used in Semisolid Dosage Forms

Ointments, Creams, Gels and Pastes

- *Vehicles (กระสายยา) = Bases (ยาพื้น)*
- *Emulsifiers or emulsifying agents (ตัวทำอิมัลชัน)*
- *Antioxidants (สารต้านออกซิเดชัน)*
- *Flavors and colors (สารแต่งกลิ่นรส และสารแต่งสี)*
- *Sweetening agent, sweeteners (สารแต่งรสหวาน)*
- *Preservatives (สารกันเสีย)*

Excipients used in Semisolid Dosage Forms

- *Vehicles (กระสายยา) = Bases (ยาพื้น)*
 - *Ointment bases (ยาพื้นขี้ผึ้ง)*
 - *Cream bases (ยาพื้นครีม): Oil, wax + water*
 - *Gel bases (ยาพื้นเจล)*

Excipients used in Semisolid Dosage Forms

- *Ointment bases (ยาพื้นขี้ผึ้ง)*

Oily bases : oil, fat, wax

Absorption bases : oil, fat, wax + surfactants

Water soluble bases : Polyethylene glycols

- *Cream bases (ยาพื้นครีม):*

Oil, fat, wax + water + emulsifying agents

- *Gel bases (ยาพื้นเจล):*

Gelling agents + water

Excipients used in Suppositories

Rectal suppositories and Vaginal suppositories

- *Vehicles = Suppository bases (ยาพื้นยาเหน็บ)*
 - *Oily bases* eg. Cocoa butter and its substitutes
 - *Water soluble bases* eg. Glycerinated gelatin, PEGs (polyethylene glycols).
 - *Water dispersible bases* eg. Tweens.

Sterile Dosage Forms

Parenterals



Ophthalmic preparations



Excipients used in Sterile Dosage Forms

Parenterals and Ophthalmic preparations

- May be solutions, suspensions or ointments
- *Vehicles*
 - *Water*
 - *Oily bases* eg. Mineral oil, petrolatum.
- *Buffers* eg. Boric acid buffer, phosphate buffer.
- *Tonicity adjustors (สารปรับสภาพตึง)*
make the solution isotonic with body fluids eg. Dextrose, sodium chloride, mannitol.

Excipients used in Sterile Dosage Forms

Parenterals and Ophthalmic preparations

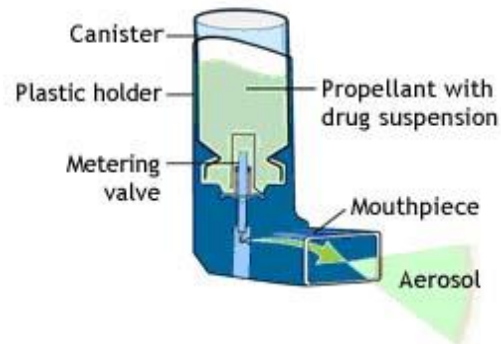
- *Preservatives* eg. Chlorobutanol, benzalkonium chloride quaternary ammonium compound.
- *Antioxidants* eg. Ethylene diaminetetraacetic acid (EDTA) sodium bisulfite, sodium metabisulfite.
- *Viscosity enhancers (สารเพิ่มความหนืด)* eg. hydroxyethylcellulose, methylcellulose, polyvinyl alcohol.

Gaseous Dosage Forms

Aerosols



Metered-dose inhalers



Gaseous Dosage Forms

- *Vehicles* eg. Water, ethanol, propylene glycol
- *Antioxidants* eg. Ascorbic acid, bisulfite.
- *Surfactants* eg. Polysorbate 80
- *Flavoring agents* eg. Aromatic oils.
- *Buffers* eg. Phosphate buffer.
- *Preservatives* eg. Benzalkonium chloride.
- *Tonicity adjustors* eg. Sodium chloride.

Gaseous Dosage Forms

- *Propellants (สารขับเคลื่อน)*
help to develop proper pressure within the container and expel the products in the forms of vapor eg. CFC (Chlorofluorocarbon).

References

1. L. Allen. (2017): *Ansel's Pharmaceutical Dosage Forms and Drug Delivery Systems*, 11th ed., Lippincott Williams & Wilkins, Philadelphia.
2. P. J. Sheskey et al. (2017). *Handbook of Pharmaceutical Excipients*, 8th ed., Pharmaceutical Press, London.J3.333
3. J.E. Thompson and L.W. Davidow. (2004). *A Practical Guide to Contemporary Pharmacy Practice*, 2nd ed., Lippincott Williams & Wilkins, Maryland.
4. Pharmacopoeias: *USP:NF, BP, TP.*

