

اقراص ومن ، هي مستحضرات توضع في الفم
وتذوب ببطء ،

اعواد دائية ، مستحضرات صلبة أو شبه صلبة تستخدم غالباً على
الجلد مباشرة

Lozenges and Medication Sticks

Instructor: Dr.Areen Alshweiat

Introduction:

□ Both are semisolid preparations, However:

- The lozenge is intended for buccal or sublingual administration → يوضع تحت اللسان، يمتص الدواء بسرعة عبر الغشاء المخاطي

يوضح بين الفم والبلع
فيبقى الدواء على الغشاء المخاطي للفم

- The medication stick is used for topical application

لـ يستخدم موضعي على الجلد



Lozenges

1. “are semisolids preparations that are intended to dissolve or disintegrate slowly in the mouth”
2. They contain one or two medicaments usually in a flavored, sweetened base
3. Used for localized effects in the mouth (most often)
4. Can be used for systemic effect if the drug is well absorbed from the buccal lining or is swallowed
5. **Troche** and **lozenge** are used interchangeably

* يمكن انهما تصنوي على حاده دوائيه أو حادتين فمن قاعده
منكهه ←
حلاوه ←
و مقبوله الطعم ←

* اغلب استعمالاته
هو هنجيه داخل الضم
لاكن ممكن يعطى تاثير
دهازي اذا الدواء امتص
في آمن بطانه الضم أو يبلع بعد ذوبانه

لهم نفس المعنى

Look for drug in the market that is in the form of lozenges? *Nicorette lozenges, strepsils*

Lozenges

Advantages:

* مناسبة للكبار والصغار ، لأنه المريض ما يحتاج يبلع القرص ، بل يتكحه يذوب في الفم

1. Easy to administer to pediatric and geriatric patients

2. The formula are easy to change and can be patient and dosing specific

* يمكن تعديل التركيبة بسهولة ، مع مراعاة الأطفال والجرعات الدقيقة

3. The drug stays in contact with the oral cavity for an extended time

* الدواء يبقى فترة طويلة في الفم ، وهذا الشيء مهم لأن بقاء الدواء من أجل يعطي تأثير موضعي أفضل في الفم والبلع

Disadvantages:

1. “Gummy type” lozenge may not be perceived by children as a serious dosage form

* يمكن الأطفال ما يشونوها أنه هذا دواء ، لكن يعتبره حلوى

وهذا يمكن يؤدي إلى فطرتناول كميه كبيره ، مشان هيلك لازم نتبع التعليمات ونبعده هذا الأطفال

Lozenges

صب المادة في قالب حتى تتصلب

تضغط المسحوق حتى يتكون حبيبات

- Can be made by molding or by compression
- * Commercial troches are made by compression using mucilages or natural gums to affect adhesion (harder than ordinary tablet so dissolve or disintegrate slowly)
- Compounded lozenges in a mold contain:
 - Sugars to form a hard lozenge
 - Polyethylene glycol (PEG) to form a soft lozenge
 - Gelatin to form a chewable lozenges

* نوعي القاعدة هو

الذي يحدد طبيعته المنتج النهائي

صلبة/طري/ قابل للمضغ

قابل للمضغ

* natural gums & mucilages ← مواد بتساعد على الالتصاق وتبطئ التفكك

* troches المنضوطة ← اقسى من اللقمان العادية، الهدف ان تذوب وتتفكك ببطء

Hard Lozenges



* التي كيميائية النموذجية تحتوي على -

(55-65%) sucrose -

(35-45%) corn syrup -

نسبة السكر مهمة ، لان التركيز غير المناسب قد يجعل المنتج grainy ، اي قشن بدل من ان يكون املس

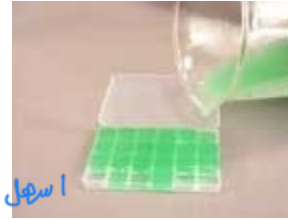
- Similar to hard candy
- Are made by heating sugars and other ingredients together to about 160 °C, then pouring the mixture into a mold
- 55-65% sucrose and 35-45% corn syrup (conc. of sugar is important so as not to become grainy)
- They require a low moisture content (0.5-1.5%) → water is evaporated by boiling the sugar mixture during the process
- Instruction should be followed carefully
- Heat labile drugs cannot be used
- The mold's shape look like a sucker or lollipop
- Hard lozenges will not disintegrate in the mouth
- They will dissolve or erode over 5-10 minutes

* الرطوبة لازم تكون منخفضة جدا (0.5-1.5%) وهذا يحدث من خلال تبخير الماء اثناء غليان خليط السكر

الادوية الحساسة للحرارة لا تفلح ، لانها تتحلل عند 160C قد تضرر المادة الفعالة

لا تتفكك بسرعة تذوب تدريجيا خلال 5-10 دقائق

Soft Lozenges



اسهل في التصنيع من hard lozenges

- Easily compounded
- Dissolve in the mouth over 10-15 minutes
- Some soft lozenges are to be chewed
- **Ingredients:** PEG 1000 or 1450, chocolate, sugar-acacia base
- Acacia add texture and smoothness
- Silica gel may be used as a suspending agent →
- PEG contract as they cool (over fill the mold)
- Ingredients should be heat stable (up to 50°C)
- The warm mixture is poured into a plastic troche mold where the correct dose of drug can be assured
- Soft textures

بعضها مخصص للمضغ وليس فقط للذوبان

acacia ← تضيف نعومة، يكون القوام أكثر تماسكاً وسلاسة

→ خصوصاً لما المادة الدوائية تكون غير ذائبة وتحتاج ان يبقى موزع داخل القاعدة

PEG ← ينكمش عند التبريد، عشان نجبي ال mold أكثر بقليل حتى لا يبرد وينكمش ببطيبي الحجم المطلوب

المكونات لازم تتحمل حراره تقل 50°، لان التصنيع يكون يتسعين لطيفه مث hard ال

Chewable Lozenges:



- “Gummy type” lozenges
- Fruit-flavored with slightly acidic taste to cover the taste of glycerin
- Intended to be chewed and swallowed
- **Popular for pediatrics**
- Most are based on the glycerinated gelatin suppository formula: glycerin, gelatin, water

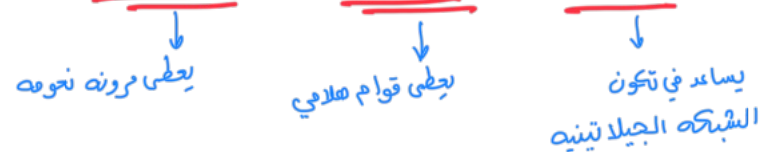
* تكون بنكهة الفواكه مع طعم حمضي ، حتى تخفي طعم glycerin

* هي مخصصة لكي تمضغ ثم تبتلع

* هي شائعة عند الأطفال لأنها تشبه الحلوى

* معظمها مثل تركيبه

تعاويل الجيلاتين



* ليس كل قالب Lozengs يجب ان يتم معايرته لكل قاعده مختلفه ؟
لان كل قاعده لها كثافه مختلفه ، وكل ماده فعاله او مضافه سوف
تأخذ حجم داخل القالب ، وتعمل إزمه لجزءاً من القاعده .

Calibration procedure

- Lozeng mold must be calibrated for each lozeng base (like any other mold e.g. suppository)
- Calibration procedure will be discussed in Chapter 17 (suppositories)
- Calibration procedure:
 1. Determine the average weight of a lozeng using only the base materials
 2. Calculate the density factor of substances that will be added to the lozeng base. Any substances added to the base will occupy a specific volume, so the amount of base required in the formulation will have to be adjusted. As an approximation if a density factor is not available, solid ingredients will displace most lozeng bases from 70-90%. Liquid ingredients will displace 100% of the base.

* عند إضافه مسحوقه او سائل الى القاعده ، فهو لا يضيف وزن فقط بل يافز حجم كمان ، لذلك يجب تقليل كميته القاعده حتى لا يفرط الحجم عن حجم القالب (في شايتر التعاميل بنوعه الصل)

Hard Lozenge

Drug	1 gm	
Powdered sugar	42 gm	يشكلان القاعدة الصلبه
Corn Syrup	16 gm	
Water	24 ml	يساعد في اذابه السكر ، ويتبخر جزء كبير منه اثناء التسقيف
Mint extract	1.2 ml	النضاج لي تمسين الطعم
Color qs		

Soft Lozenge

Drug	1 gm
Polyethylene glycol 1000	10 gm
	القاعده الاساسيه و يعطي القوام الطري
Aspartame	20 packets
	للتقليل بدل السكر ، مفيد لتقليل السكر
Mint extract	1 ml
Color qs	

Chewable Lozenge

Drug	0.5 gm
Glycerin	70 ml
	يعطي المرونة والحليص المطاطي
Gelatin	18 gm
	يعطي الشكل الهلامي
Water	12 ml
Methylparaben	0.4 gm
	ماده حافظه لان الماد glycerol قد يسمح بنمو بكتيري
Flavoring oil	3 to 4 drops
Color qs	

Dr.Saja Hamed Dr.Tamara Athamneh Dr.Areen Alshweiat

Medication Sticks



- **Sticks** are an easily transportable and convenient dosage form for administering topical medications.
- They can be compounded in different sizes and shapes for application to different areas of the body.
- They can be applied directly to the affected site of the body for local activity.
- Or they can be applied to different epidermal sites if systemic activity is desired. Epidermal penetration enhancers can be added to the formulation to promote this later use.
- Sticks get their consistency from a combination of waxes, polymers, resins
- Local anesthetics, sunscreens, antivirals, and antibiotics

هي شكل دوائي سهل الحمل ومريح للاستعمال، ويُستخدم لإعطاء أدوية موضعية Medication sticks

يمكن تحضيرها بأحجام وأشكال مختلفة حسب مكان الاستخدام، مثل:

الشفاه

الجلد

منطقة صغيرة مصابة

الكعب أو مناطق التقرن

لدغات الحشرات

تُطبق مباشرة على المنطقة المصابة لإعطاء تأثير موضعي.

لكن أحياناً يمكن استخدامها على الجلد للحصول على تأثير جهازى، بشرط إضافة مواد تزيد اختراق الجلد تسمى:

Epidermal penetration enhancers

القوام في sticks ينتج من خليط مواد مثل:

Waxes

Polymers

Resins

أمثلة على أدوية يمكن وضعها في sticks:

Local anesthetics

Sunscreens

Antivirals

Antibiotics

يعني يمكن أن تكون لتسكين الألم، الحماية من الشمس، علاج الفيروسات الجلدية، أو المضادات الحيوية الموضعية.

* هذه المواد تكون وشموم حتى تلين على حرارة الجسم ، و يتوزم الدواء بسهولة على الجلد

* ومن صفاتها :- 1- تنفخ بشكل متساوي على المنطقة المراد

2- لا تترك بقايا واضحة visible residue

3- تكون شفافة clear او معتمة opaque

Soft Sticks

- Medication sticks contain waxes, polymers, oils, and gels (or combination of theses) that will soften at body temperature
- Allow the formulation to be spread evenly over the affected area and they leave no visible residue
- Clear or opaque depending on the base
- Soft clear sticks contain sodium stearate, glycerin, and/or propylene glycol in their base. → هذه المواد تغطي قاعده شفافة نسبياً وقابله للانلاذ على الجلد
- Soft opaque stick bases may contain petrolatum, cocoa butter, and polyethylene glycol (PEG). → هذه المواد تغطي قوام دهني أو شمومي ويكون شكلها مثل الشمعات

Soft Sticks

* القوام يعتمد على توازن المواد ذات درجات الانصهار العاليه والمنفقه

- Soft stick consistency is determined by the blend of high and low melting point ingredients used as the base.
- Sometimes additional high melting point ingredients are added to "stiffen" (i.e., make more solid) some bases.

نضيفها لئلا تكون القاعده طريه وهي عواد تجعلها اكثر صلابه

↓
جعل القاعده اقسى والشيء تماسك

عند تحضير خليط يحتوي مواد مختلفة melting points، نبدأ بإذابة المادة ذات أعلى درجة انصهار أولاً، ثم نضيف التي بعدها، وهكذا.

Ingredient	Melting Point (°C)
Carnauba wax	81 - 86
Cetyl alcohol	45 - 50
Cetyl esters wax	43 - 47
Cholesterol	147 - 150
Cocoa butter	30 - 35
Glyceryl monostearate	55
Stearic acid	69 - 70
Stearyl alcohol	55 - 60
White wax (Beeswax, white and yellow)	62 - 65
PEG 1500	44 - 48
PEG 3350	54 - 58
PEG 6000	58 - 63

لماذا؟
حتى لا نعرض المواد منخفضة الانصهار لحرارة عالية لفترة طويلة، لأن ذلك قد يسبب:

تلف المادة
تطاير بعض المكونات
تغير الرائحة
تغير القوام
تدهور المادة الفعالة

When combining materials that have a range of melting points, it is best to melt the material with the highest melting point first, and then melt the material with the second highest melting point second, and so forth. As each new ingredient is added to the melt, the temperature can be reduced. This will prevent over heating the lower melting point ingredients.

* الـ Hard stick لا يعمل مباشرة وهو جاف ، يجب ترطيبه أولاً .
عند ترطيبه يتكون حللول مركز من الدواء على الجزء المبلل من stick
وعند مسه للجلد ، ينتقل هذا الحلول الى المنطقة المراد
* من عيوبه انه قد يترك بقايا بيضاء على الجلد بسبب المسامية البلورية

Hard Sticks

- Hard sticks are made of crystalline powders that are either fused together by heat or held together with a binder.
- The stick must be moistened to be "activated." When it is wetted, a concentrated solution of the drug forms on the wetted part of the stick and the solution is transferred when the stick is touched to the affected area.
- The crystalline powder in the stick may leave a white residue on the skin.
- The prime example of a hard stick is a styptic pencil.

← قلم يستخدم لإيقاف النزف البسيط

هو قلم في antihemorrhagic ، وهي مادة تساعد في إيقاف النزف agent

- A **styptic** (also spelled **stiptic**) is a specific type of antihemorrhagic agent that works by contracting tissue to seal injured blood vessels. Styptic pencils contain astringents. (wikipedia)

* بجلي القباهن في الانسجه حتى يساعد على إغلاق الدمويه الدويه

مواد قابضه



Soft Opaque Stick

← صلابه وقوام شمعي	White Beeswax	30 gm
← يزيد التماسك ويحسن الملمس	Cetyl alcohol	8 gm
← نعومه ، يزوب على حرارة الجسم	Cocoa butter (or FattibaseT)	6 gm
← شديد الصلابه ويرفع درجة الانصهار	Carnauba wax	1 gm
← يعطي انزلاق وتطيب	Castor Oil Tasteless	2 ml
	AquabaseT	20 gm
قاعده دهنيه واقية	Petrolatum	13.5 gm
نمسين الرائحة	Perfume	0.9 ml
للمحاربة عن الميكروبات	Preservative	0.1 gm
	Butyl Stearate	5 mg
	Active Drug qs	

Dr.Saja Hamed Dr.Tamara Athamneh Dr.Areen
Alshweiat

Soft Clear Stick

معالج مكون للجلد ، قائمه عليه شفاه

Sodium stearate

13%

مسكن / مضاد ألم موضعي + له رائحة مميزة

Methyl salicylate

35%

يعطي احساس بالبرودة ويساعد في تنظيف الالم والحكة

Menthol

15%

عذبة ومرطبة ويسمن افتراق الجلد

Propylene glycol

25%

Water

12%

Hard Stick → ترکیبہ تعدد علی اصلاح غیر عضو یہ

Ammonium chloride	7 gm
Aluminum sulfate	27 gm
Ferric sulfate	40 gm
Copper sulfate	26 gm

هذه المواد لما تنطبق تعطي محلول مركب على سطح stick ، ثم على الجلد ليغطي تأثير موضعي

Filling Applicators

* الفكرة ليست مجرد تغليف ، هي وسيلة اعطاء تساعد المريض على استخدام المستحضر دون لمس المادة باليد

- Applicators are administration devices that hold the medication stick formulation
- Two sizes are typically available: 45 g and 5 g (lip balm)
- After all the ingredients have been incorporated into a melt, they are aplicator



* بعد اذابه وخط المكونات ، يتم صب الخليط المنصهر داخل applicator ويترك حتى يبرد ويتصلب

Observing the formulations for evidence of instability

- The USP Chapter <1191> has no specific recommendations for lozenges and sticks for signs of instability
- In general, the primary indication of instability is either discoloration or a change in consistency or odor
- Hard lozenges and PEG polymer (hygroscopic and soften at elevated temperature)
- Store in tight containers and keep it from drying out (especially chewable lozenges)

طريقه عند مراره عاليه

عبوات محكمة الاغلاقت بعيداً عن الحرارة والرطوبة

تمتص الرطوبة

يجب منعها من العفان، لأنها اذا فقدت الماء تصبح قاسيه وتتشقق ويتغير خواصها