

WROCLAW  
MEDICAL UNIVERSITY

## Sposób wytwarzania tabletki flotacyjnej o przedłużonym działaniu

## Manufacturing process of a sustained release flotation pill

Projekt finansowany ze środków programu SPIN-TECH  
Narodowego Centrum Badań i Rozwoju





## Sposób wytwarzania tabletki flotacyjnej o przedłużonym działaniu

### Streszczenie

Przedmiotem oferty jest sposób wytwarzania tabletki flotacyjnej o przedłużonym oddziaływaniu substancji leczniczych z błoną śluzową żołądka oraz kompozycja farmaceutyczna, mające zastosowanie w szczególności w leczeniu schorzeń żołądka. Zastosowanie nowego rozwiązania pozwoli otrzymywać tabletki o ustalonych właściwościach flotacyjnych i mechanicznych, co pozwala zapewnić większą trwałość substancji leczniczej zawartej w tabletkce oraz większą trwałość samej tabletki.

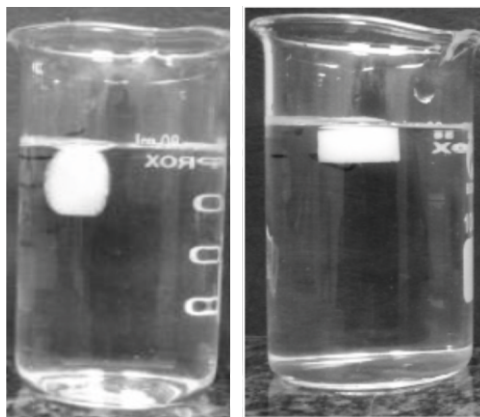
### Opis technologii

Powierzchnia żołądka jest niewielka, a czas przebywania w nim leków i pokarmów ograniczony, dlatego też są one przyswajane tu tylko częściowo. Leki podawane doustnie przedostają się do organizmu z żołądka mniej więcej w połowie dawki. Dzięki opracowanej, nowej technologii może się to zmienić.

Sposób polega na zastosowaniu odpowiedniego składu jakościowo ilościowego oraz sposobu postępowania w celu uzyskania nośnika substancji leczniczych o korzystnych właściwościach użytkowych i zdolności do flotacji na powierzchni płynu żołądkowego. Wykonano serię badań weryfikujących podstawowe właściwości otrzymanych preparatów, w tym zwłaszcza właściwości flotacyjne. Została wykonana odpowiednia dokumentacja. Głównym badaniem weryfikującym były badania dostępności farmaceutycznej, tj. badania kinetyki uwalniania modelowej substancji czynnej do płynu akceptorowego, odzwierciedlającego środowisko płynu żołądkowego. Technologia jest na etapie praktycznego rozwiązania.

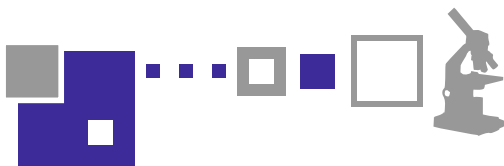
### Opis grupy docelowej

Grupą docelową dla proponowanej technologii są jednostki przemysłu farmaceutycznego produkujące leki z grupy kardiologicznych, przeciwcukrzycowych, leków na nadkwaśność, a także niektórych antybiotyków. Zastosowanie technologii jest bardzo szerokie, ponieważ sama technologia dotyczy formy podania leku, nie zaś substancji czynnej o właściwościach biologicznych. Możliwe jest zastosowanie sposobu do uzyskania szeregu leków, dla których efekt flotacji w trakcie ich podania ma kluczowe znaczenie dla osiągnięcia pożądanego efektu terapeutycznego i korzystnym miejscem oddziaływania jest błona śluzowa żołądka. Technologia może być sprzedana jednej z firm farmaceutycznych bądź rozwinięta wraz z partnerem i udostępniana wielu firmom.



Rysunek 1. Tabletki flotacyjna unosząca się na powierzchni płynu

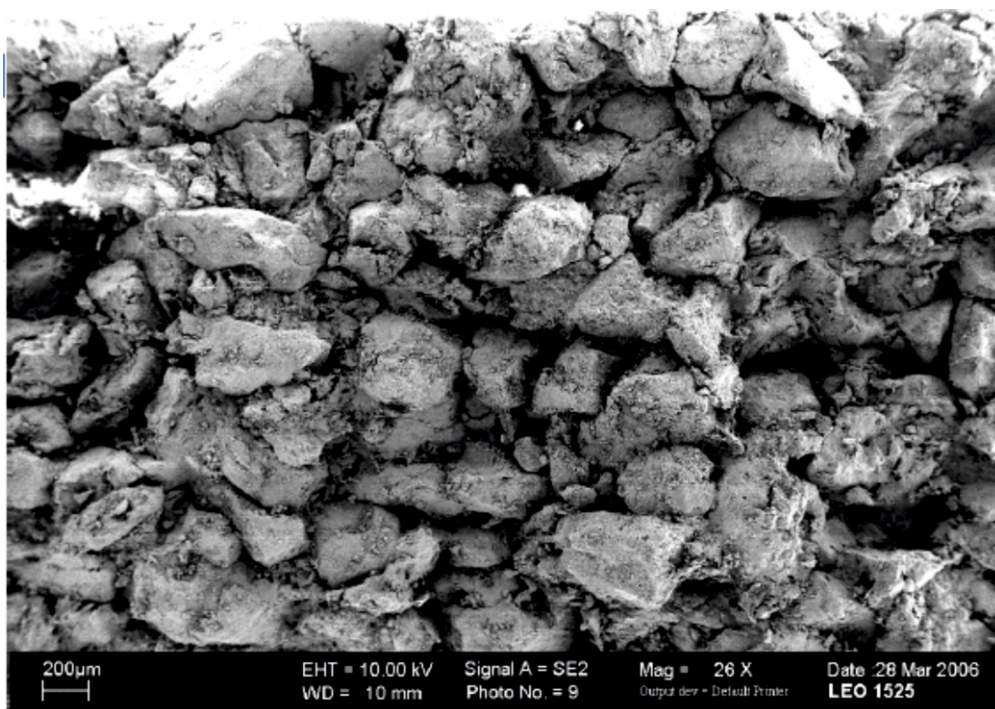
Oba zdjęcia przedstawiają wynalazek w użyciu. Tabletki uzyskała efekt flotacji w laboratoryjnie odtworzonych warunkach, jakie znajdują się w żołądku.

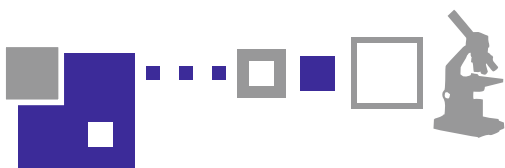


### Analiza konkurencji

- W chwili obecnej tabletki flotacyjne produkowane są w sposób zmierzający do uzyskania formulacji o gęstości mniejszej niż gęstość wody, co umożliwia utrzymywanie się takich preparatów na powierzchni płynu żołądkowego lub blisko jego powierzchni. W tym celu stosuje się mieszaniny wybranych polimerów, takich jak np. pochodne celulozy, w połączeniu z substancją czynną. Do mieszaniny tej dodaje się wodorowęglan sodu lub potasu, oraz często także kwas organiczny. Wydzielający się w kontakcie z wodą dwutlenek węgla zapewnia flotację tabletki w środowisku żołądka, jednakże dochodzi do powstania pęcherzy gazu, które mogą powodować poczucie dyskomfortu u pacjenta.

Rysunek 2. Obraz z mikroskopu SEM przedstawiający mikrostrukturę tabletki flotacyjnej





## Zalety Technologii

Cecha technologii	Korzyść	
Brak konieczności stosowania mieszanin kwasów organicznych i wodorowęglanów wrażliwych na wodę.	Większa trwałość substancji leczniczej zawartej w tabletkach, oraz większa trwałość samej tabletki.	V
Sposób wytwarzania nie przewiduje wykorzystania organicznego rozpuszczalnika.	Brak niekorzystnego dla środowiska efektu.	V
Brak konieczności zastosowania wodorowęglanu sodu.	Nie dochodzi do powstania pęcherzy dwutlenku węgla, które mogą powodować poczucie dyskomfortu u pacjenta.	V
Obecności polimeru kwasowego.	Możliwość uzyskania efektu flotacji wytworzonych tabletek u pacjentów z niedokwaśnością soku żołądkowego.	V

Dalsze badania nad rozwojem przedstawionej technologii prowadzone będą w Katedrze i Zakładzie Chemii Fizycznej na Wydziale Farmaceutycznym Uniwersytetu Medycznego im. Piastów Śląskich.





## Manufacturing process of a sustained release flotation pill

### Summary

The subject of this offer is the manufacturing process of a flotation pill with sustained release of medicinal substances with effect on gastric mucosa and its pharmaceutical composition which are applicable especially when treating gastrointestinal disorders. The application of the new solution will make it possible to obtain pills with established flotation and mechanical properties, which allow to ensure higher endurance of medicinal substance contained in the pill and higher endurance of the pill itself.

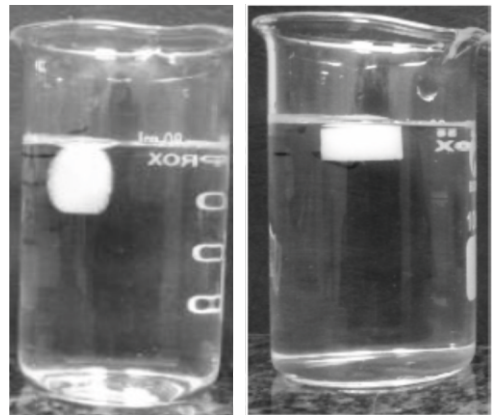
### Technology description

The surface of the stomach is small, and the period when medicines and foods remain there is limited, therefore they are only absorbed partially. Oral medicines enter into the system from the stomach more or less as a half dose. Thanks to newly developed technology it can be changed.

The technology involves the application of appropriate quality and quantity composition, as well as a procedure in order to obtain a carrier for medicinal substances with beneficial properties and flotation capacity on the surface of the gastric fluid. A series of tests was conducted in order to verify basic properties of obtained agents, including flotation properties. Appropriate documentation was prepared. The main verifying test included dissolution testing, i.e. kinetics tests of active modelling substance release into the acceptor fluid resembling stomach fluid conditions. This technology is at the stage of practical solution.

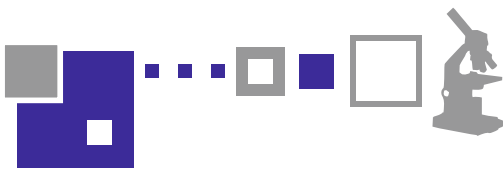
### Target group description

Target group for the offered technology are pharmaceutical industry units manufacturing cardiological drugs, antidiabetic drugs, medicines for hyperacidity, as well as some antibiotics. The application of the technology is very broad as the technology itself involves the method of administering a medicine and not the active substance with biological properties. It is possible to apply the method in order to obtain numerous medicines for which the flotation effect is essential to achieve the desirable therapeutic effect; beneficial interaction site is gastric mucosa. The technology can be sold to one of the pharmaceutical companies or developed with a partner and made available to many companies.



**Fig. 1. Flotation pill floating on the surface of fluid**

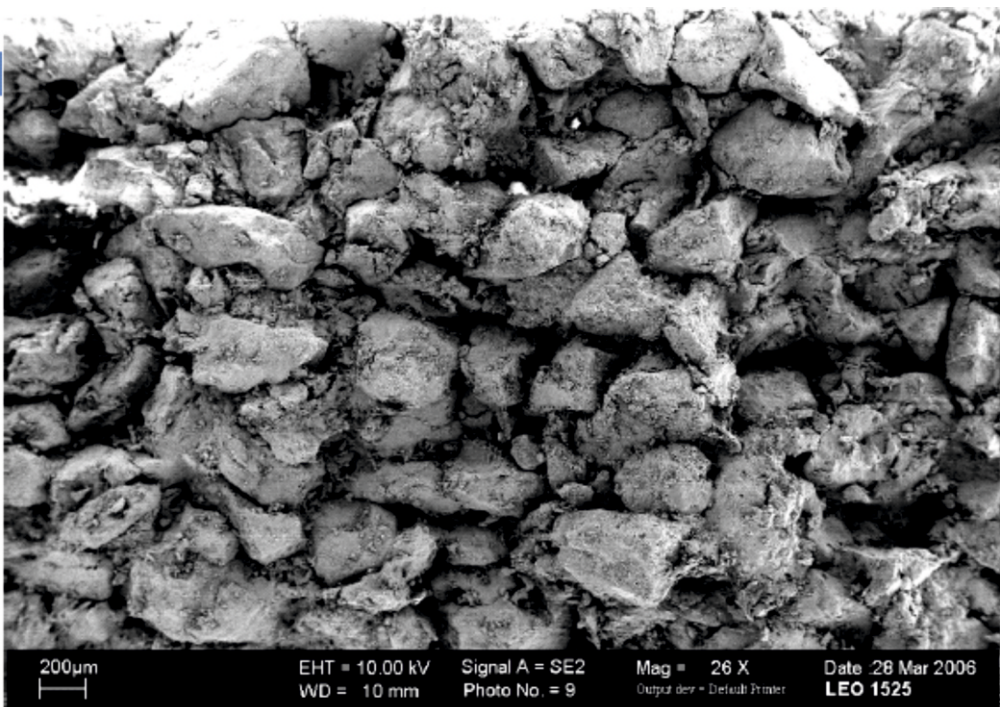
Both images present the product in use. The pill achieved the flotation effect in laboratory conditions resembling stomach conditions.

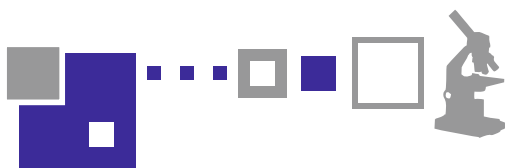


### Analysis of the competition

- Currently flotation pills are manufactured so that they obtain formulation with density lower than the density of water which allows the pills to float on the surface of the gastric fluid or close to its surface. For this purpose mixtures of selected polymers are used, such as cellulose derivatives, in combination with an active ingredient. The mixture also contains sodium bicarbonate or potassium, and often organic acid, as well. Carbon dioxide, released when in contact with water, ensures flotation of the pill in the stomach, however the patient may experience some discomfort due to the occurrence of gas bubbles.

Fig. 2. SEM microscope image presenting the microstructure of the flotation pill



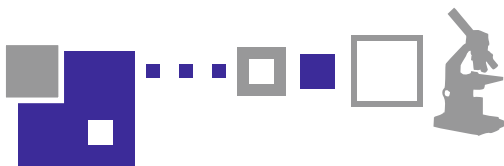


### Advantages of the technology

Technology feature	Benefit	
No need to use mixtures of organic acids and bicarbonates sensitive to water.	Higher endurance of the medicinal substance contained in the pill and higher endurance of the pill itself.	V
Production process does not allow the use of an organic solvent.	It does not have an adverse effect on the environment.	V
No need to use sodium bicarbonate.	Carbon dioxide bubbles, which may cause patient discomfort, do not occur.	V
Presence of an acidic polymer.	It is possible to achieve the flotation effect of the pills in patients with hypoacidity.	V

Further research on the development of the presented technology will be conducted in the Department of Physical Chemistry at the Faculty of Pharmacy of Wrocław Medical University.





WROCLAW  
**MEDICAL UNIVERSITY**



**Kontakt w sprawie oferty:**  
**Uniwersytet Medyczny im. Piastów Śląskich we Wrocławiu**  
**Centrum Innowacji i Transferu Technologii**  
**ul. Chałubińskiego 6**  
**50-368 Wrocław**  
**e-mail: [citt@umed.wroc.pl](mailto:citt@umed.wroc.pl)**  
**tel. +48 71 784 11 48**

**Contact on offer:**  
**Wroclaw Medical University**  
**Centre for Innovations and Technology Transfer**  
**Chalubinskiego 6**  
**50-368 Wroclaw**  
**e-mail: [citt@umed.wroc.pl](mailto:citt@umed.wroc.pl)**  
**phone: +48 71 784 11 48**



Projekt finansowany ze środków programu SPIN-TECH  
Narodowego Centrum Badań i Rozwoju

