



We create chemistry

Teknik Bilgiler

İbuprofen 25, 38, 50, 70

İbuprofen DC 85 W

Rasemik İbuprofen Lizinat

İbuprofen Sodyum Dihidrat





**25 YILI AŞKIN SÜREDİR BISHOP,
TEKSAS TESİSİMİZDE İBUPROFEN
ÜRETMEKTEYİZ. DENEYİMLİ VE İŞ
BİRLİĞİNİ ESAS ALAN BİR ORTAK
OLARAK, KÜRESEL VE BÖLGESEL
VARLIĞIMIZLA BİRİNCİ SINIF
REGÜLASYON, KALİTE VE TEKNİK
SERVİS DESTEĞİ SAĞLIYORUZ.**

İindekiler

Giriř	6
--------------	----------

İbuprofen	8
------------------	----------

Kimyasal bilgiler	8
Kimyasal ve fiziksel zellikler	9
Partikl karakterizasyonu	10
İbuprofen DC 85 W	12
İbuprofen uygulamaları hakkında genel bilgiler	14
ZoomLab™ – Sanal Formlasyon Asistanınız	15
rnek formlasyonlar	16
Kullanım ve Gvenlik	18
rn zellikleri	18
Reglasyon ve Kalite	18
Yayınlar	18
PRD ve rn numaraları	18
MyProductWorld ve RegXcellence®	19

Rasemik İbuprofen Lizinat (RIBL)	20
---	-----------

Kimyasal bilgiler	20
rn bilgisi	20
Kimyasal ve fiziksel zellikler	21
Partikl karakterizasyonu	21
Reglasyon durumu	21
zellikler	21
Tıbbi endikasyon	22

İbuprofen Sodyum Dihidrat	24
----------------------------------	-----------

Kimyasal bilgiler	24
rn bilgisi	24
Depolama	25
Reglasyon durumu	25
zellikler	25
Tıbbi endikasyon	26



DÖRT FARKLI TOZ
TÜRÜNDE, **DOĞRUDAN**
SIKIŞTIRILABİLİR
FORMDA VE İKİ ADET
HIZLI ETKİ GÖSTEREN
TÜRDEN **OLUŞAN**
GENİŞ BİR PORTFÖY
SUNUYORUZ.



Giriş



Tıbbi endikasyon

İbuprofen, steroid olmayan anti-inflamatuar ilaçlar (NSAID'ler) sınıfına ait bir kiral propiyonik asit türevidir.

Analjezik, anti-piretik ve anti-inflamatuar etkileri nedeniyle romatoid artrit, osteoartrit, hafif ila orta şiddette ağrı, dismenore, baş ağrısı ve ateş gibi inflamasyon durumlarının tedavisinde kullanılır.¹

Tabletlerdeki yaygın etken madde dozu 200, 400, 600 ve 800 mg'dır. Reçetesiz satılan dozaj formları esas olarak 200 ve 400 mg formlardır (Amerika Birleşik Devletleri ve 200 mg formunun tek reçetesiz satılan form olduğu diğer bazı ülkeler hariç). Diğer yaygın dozaj formları, kapsüller, şuruplar, süspansiyonlar, supozituarlar ve kremler ve jeller gibi topikal dozaj formlarıdır.



Farmakokinetik

Oral olarak uygulanan ibuprofen, sindirim yolunda hızla emilir.² Aç karnına tek bir oral dozdan sonra, 45 ila 90 dakika içinde doruk plazma düzeylerine ulaşılır ve sanal plazma dağılım hacminin 0,1 ila 0,2 l/kg arasında olduğu bildirilir.³⁻⁵

İbuprofen kapsamlı bir protein bağlama kapasitesine sahiptir (>%98)⁶⁻⁷ ve böbrekler yoluyla atılır. Biyolojik yarı ömrü 2 ile 4 saat arasındadır.² 24 saat sonra etken maddenin %100'ü idrarla atılır.⁸





Farmakoloji

İbuprofenin etki mekanizması tam olarak anlaşılamamasına rağmen, hücresel membrandaki araşidonik asitten prostaglandinlerin (PG'ler) biyosentezinden sorumlu olan siklooksijenaz (COX) enziminin geri dönüşümlü inhibisyonununundan kaynaklandığı düşünülmektedir.⁹

Prostaglandinler çeşitli dokularda dağılır ve diğer özelliklerinin yanı sıra düz kaslar üzerinde güçlü bir etkiye sahiptir. İnflamasyon uyarıcısı varlığında veya kan dolaşımı bozuklukları durumunda, PG'ler artan miktarlarda sentezlenir ve dokuları histamin ve kininler gibi diğer ajanların etkisine karşı duyarlı hale getirir. Bunun sonucunda ağrı ve iltihaplanma gibi belirtiler ortaya çıkar. Ateş, PG'lerin hipotalamustaki ısı düzenleme merkezi üzerindeki etkisiyle meydana gelir. Burada, vücut sıcaklığı normal değeri olan 37 °C'ye yükseltilir.¹⁰

Referanslar

- ¹ ABD Gıda ve İlaç Dairesi "Ibuprofen Drug Facts Label" 6 Nisan 2016'da Revize Edildi.
- ² Davies, N. M., "Clinical Pharmacokinetics of Ibuprofen," Clinical Pharmacokinetics, 34:101-154, 1998.
- ³ Gillespie, W. R. ve diğerleri, "Relative Bioavailability of Commercially Available Ibuprofen Oral Dosage Forms in Humans," Journal of Pharmaceutical Sciences, 71:1034-1038, 1982.
- ⁴ Verbeeck, R. K., "Pathophysiologic Factors Affecting the Pharmacokinetics of Nonsteroidal Anti-Inflammatory Drugs," Journal of Rheumatology, 15:44-57, 1988.
- ⁵ Jamali, F. ve D. R. Brooks, "Clinical Pharmacokinetics of Ketoprofen and Its Enantiomers," Clinical Pharmacokinetics, 19:197-217, 1990.
- ⁶ Vowles, D. T. ve B. Marchant, "Protein Binding of Ibuprofen and Its Relationship to Drug Interactions," British Journal of Clinical Practice, 1:13-19, 1980.
- ⁷ Whitlam, J. B. ve K. F. Brown, "Ultrafiltration in Serum Protein Binding Determinations," Journal of Pharmaceutical Sciences, 70:146-50, 1981.
- ⁸ Rudy, A. C. ve diğerleri, "Stereoselective Metabolism of Ibuprofen in Humans: Administration of R-, S- and Racemic Ibuprofen," Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics, 259:1133-1139, 1991.
- ⁹ Neupert, W. ve diğerleri, "Effects of Ibuprofen Enantiomers and Its Coenzyme a Thioester on Human Prostaglandin Endoperoxide Synthases," British Journal of Pharmacology, 122:487-92, 1997.
- ¹⁰ Ricciotti, E. ve G. A. FitzGerald, "Prostaglandins and Inflammation," Arteriosclerosis Thrombosis, and Vascular Biology, 31(5): 986-1000, 2011.



İbuprofen

Kimyasal bilgiler

İbuprofen

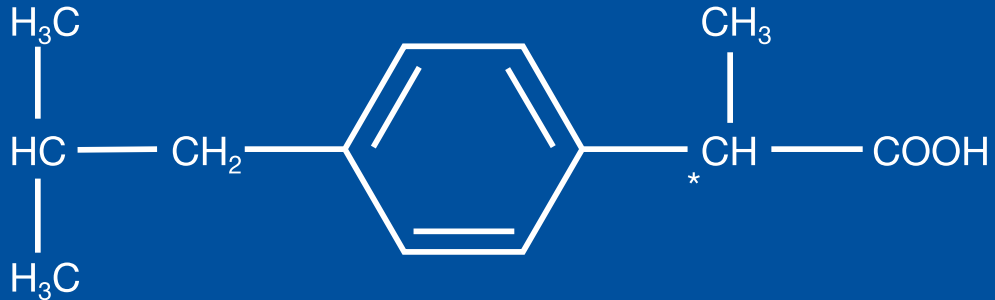
Kimyasal adı	(2RS)-2[4-(2-Metilpropil)fenil]propiyonik asit
CAS numarası	15687-27-1
EINECS numarası	239-784-6
Molekül formülü	C ₁₃ H ₁₈ O ₂
Molekül ağırlığı	206.28 g/mol
Ürün sınıfları	BASF, farklı partikül boyutu dağılımlarına sahip 4 farklı tür sunar (partikül karakterizasyonuna bakınız). Ayrıca, doğrudan basılabilir bir tür de sunulmaktadır: İbuprofen DC 85 W ürününün bileşimi aşağıdaki kimyasal ve fiziksel özellikler bölümünde bulunabilir.
Eş anlamlıları	(±)-2-[4-(2-metilpropil)fenil]propiyonik asit; (±)-Benzenasetik asit, alfa-metil-4-(2-metilpropil); (±)-p-İzobütilhidratropik asit; (±)-2-p-İzobütilfenilpropiyonik asit
Regülasyon durumu	İbuprofen mevcut Ph. Eur., USP, JP ve IP monograflarının gerekliliklerini karşılar. DMF'ler ve CEP talep üzerine mevcuttur.

İbuprofen, (+)-İbuprofen ve (-)-İbuprofen'in rasemik karışımıdır (optik rotasyon = 0°). Literatüre göre farmakolojik olarak aktif formu (+)-İbuprofendir.*

(-)-İbuprofenin yaklaşık %30 ila %70'i vücutta aktif (+)-İbuprofen formuna dönüştürülür. Bu işlem yalnızca (-)- biçiminden (+)- biçimine doğru ilerler.

Yapısal formül:

İbuprofen

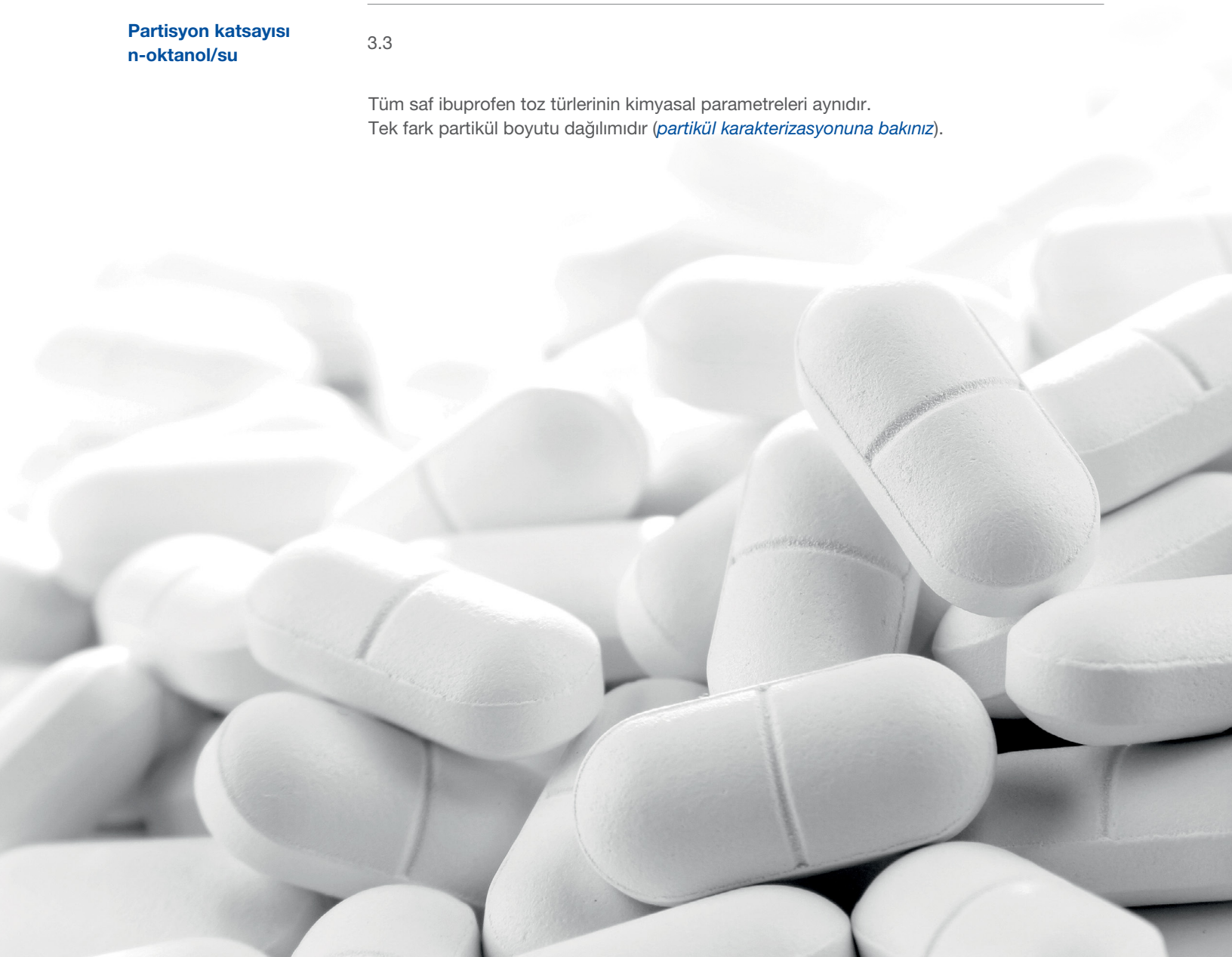


Kimyasal ve fiziksel özellikler

İbuprofen sınıfları 25, 38, 50, 70

Görünüm	Kristal toz
Renk	Beyaz
Koku	Karakteristik
Erime aralığı	75–78 °C
Fosfat tamponunda çözünürlük pH 7,2 (37 °C)	5,2 mg/ml
Partisyon katsayısı n-oktanol/su	3.3

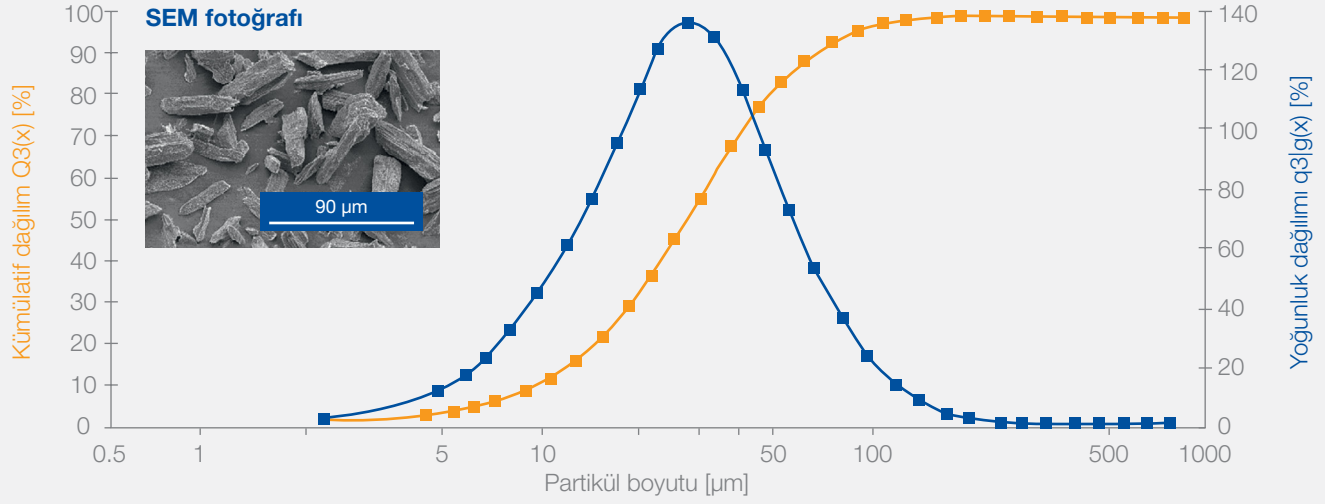
Tüm saf ibuprofen toz türlerinin kimyasal parametreleri aynıdır.
Tek fark partikül boyutu dağılımıdır ([partikül karakterizasyonuna bakınız](#)).





Partikül karakterizasyonu

İbuprofen 25 Partikül Boyutu Dağılımı

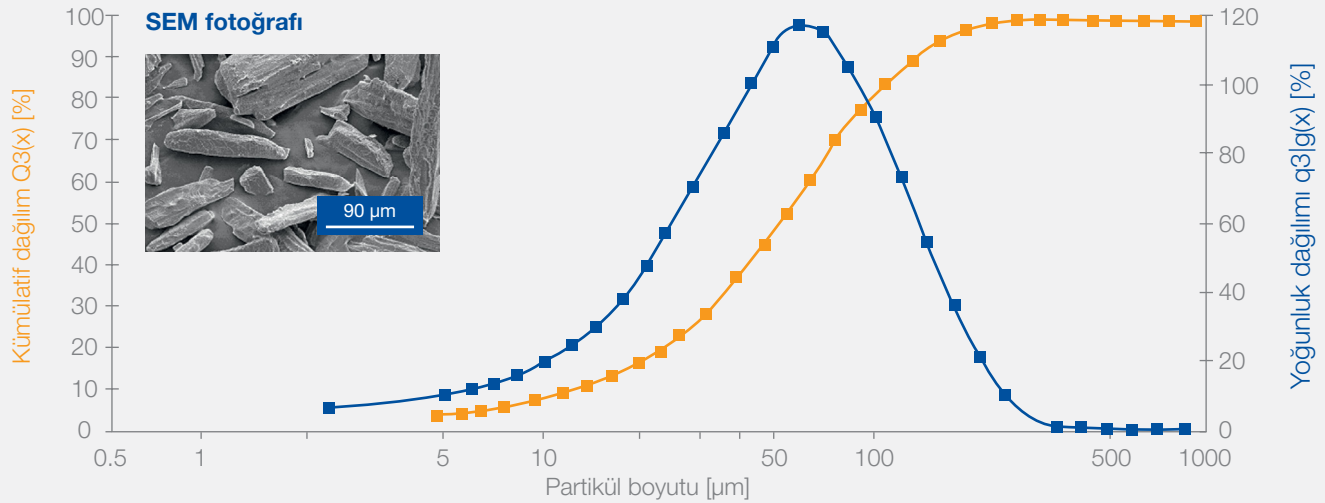


Kuru toz morfolojisi kullanılarak lazer kırınımı ile belirlenen partikül boyutu dağılımının bir örneği yukarıdaki şemada verilmiştir. **İbuprofen 25 için medyan partikül boyutu, 20 µm ve 33 µm arasındadır.**

Yığın yoğunluk
Sıkıştırılmış yoğunluk

Yaklaşık 0.30 g/ml.
Yaklaşık 0.48 g/ml.

İbuprofen 50 Partikül Boyutu Dağılımı

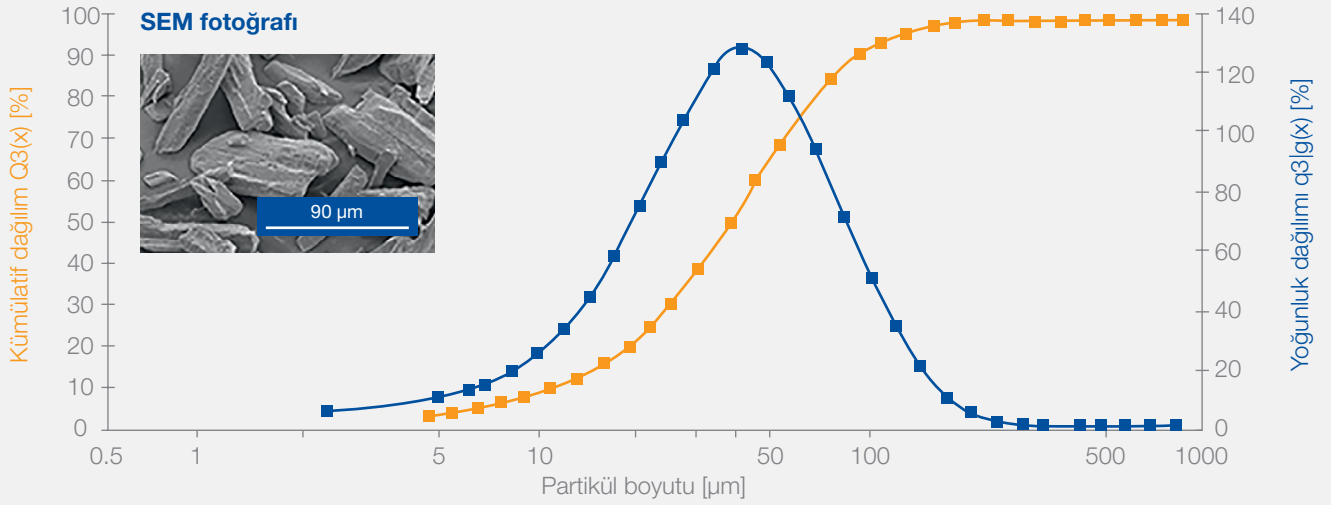


Kuru toz morfolojisi kullanılarak lazer kırınımı ile belirlenen partikül boyutu dağılımının bir örneği yukarıdaki şemada verilmiştir. **İbuprofen 50 için medyan partikül boyutu, 45 µm ve 60 µm arasındadır.**

Yığın yoğunluk
Sıkıştırılmış yoğunluk

Yaklaşık 0.34 g/ml.
Yaklaşık 0.60 g/ml.

İbuprofen 38 Partikül Boyutu Dağılımı

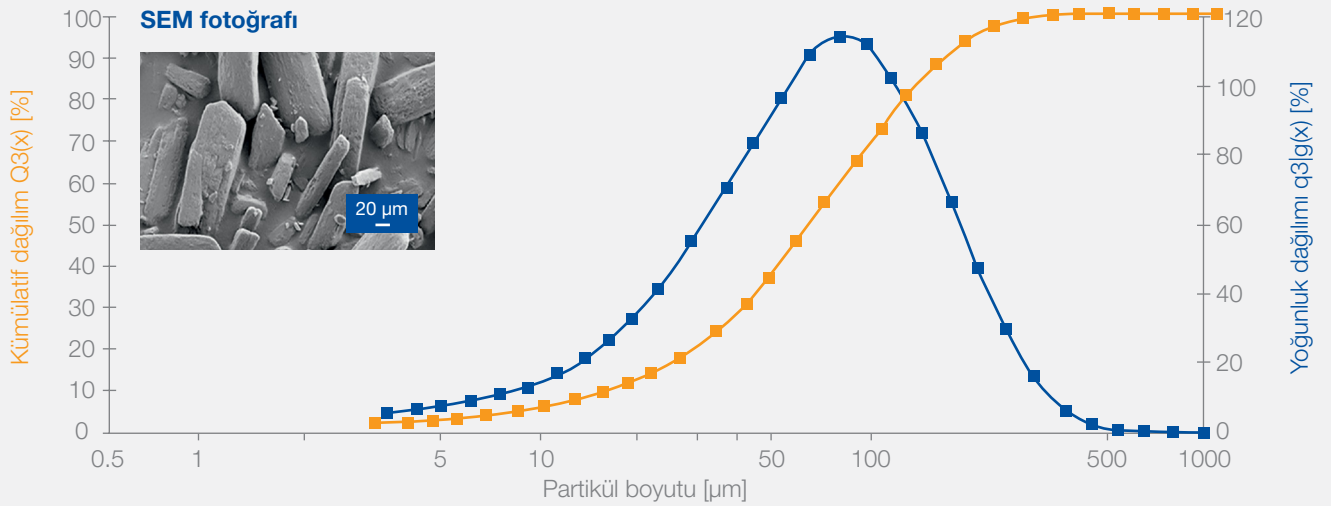


Kuru toz morfolojisi kullanılarak lazer kırınımı ile belirlenen partikül boyutu dağılımının bir örneği yukarıdaki şemada verilmiştir. **İbuprofen 38 için medyan partikül boyutu, 33 µm ve 45 µm arasındadır.**

Yığın yoğunluk
Sıkıştırılmış yoğunluk

Yaklaşık 0.33 g/ml.
Yaklaşık 0.60 g/ml.

İbuprofen 70 Partikül Boyutu Dağılımı



Kuru toz morfolojisi kullanılarak lazer kırınımı ile belirlenen partikül boyutu dağılımının bir örneği yukarıdaki şemada verilmiştir. **İbuprofen 70 için medyan partikül boyutu, 60 µm ve 85 µm arasındadır.**

Yığın yoğunluk
Sıkıştırılmış yoğunluk

Yaklaşık 0.38 g/ml.
Yaklaşık 0.68 g/ml.

İbuprofen DC 85 W

Görünüm	Granüller, akışı çok iyi, homojen madde
Renk	Beyaz
Miktar Tayini	%82–88

İbuprofen DC 85 W üretmek için kullanılan İbuprofen mevcut Ph. Eur., USP, JP ve IP monograflarının gereksinimlerini karşılar. Teknik Paket ve US-DMF talep üzerine mevcuttur.

Partikül Boyutu Dağılımı

Elek analizi	0.850 mm elekte minimum %15 oranında kalır. 0.640 mm elekte minimum %45 oranında kalır.
Yığın yoğunluk	Yaklaşık 0.55 g/ml.
Sıkıştırılmış yoğunluk	Yaklaşık 0.64 g/ml.
Akış açısı	33°

SEM fotoğrafı



Tipik bileşim

İbuprofen 50	%84.66–85.34
Mikrokristalin Selüloz	%6.59–6.67
Kolloidal Silikon Dioksit	%5.34–5.52
Kroskarmelloz Sodyum	%2.86–3.02



Doğrudan basılabilirlik için öneri

Günümüzde ibuprofen tabletlerinin üretimi genellikle doğrudan basım ile yapılmaktadır. Bu yöntemi kullanarak, pahalı ve zaman alıcı yaş granülasyon yönteminden kaçınılabilir. Ancak genel olarak ibuprofen, tablet baskı sırasında yapışma dezavantajına sahip olduğundan proses sık sık kesintiye uğramak zorunda kalır.

Bu nedenle tablet başına yüksek ibuprofen içeriğine sahip doğrudan basım formülasyonlarından sıklıkla kaçınılır. Çoğunlukla tabletler en fazla %60 ibuprofen içeriği ile basılır.

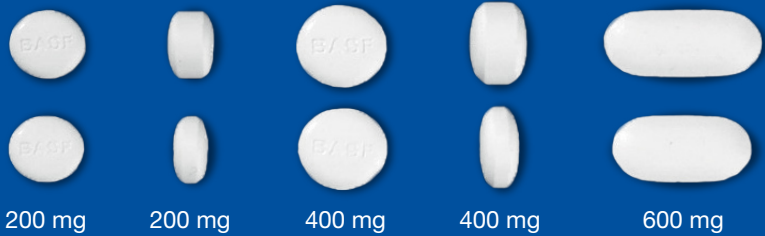
BASF, doğrudan basım için ideal olarak formüle edilmiş bir ibuprofen ürünü sunar: İbuprofen DC 85 W. Doğrudan basılabilir (DC) türü, tablet yapışmasının en aza indirilmesini ve mükemmel tablet yüzeyi ve baskısı sağlar.

Ayrıca İbuprofen DC 85 W, standart sınıflara kıyasla daha düşük bir akış açısına sahiptir ve bu da akışkanlığın daha iyi olduğunu gösterir.



**Mevcut ticari ürünler
(İbuprofen 50)**

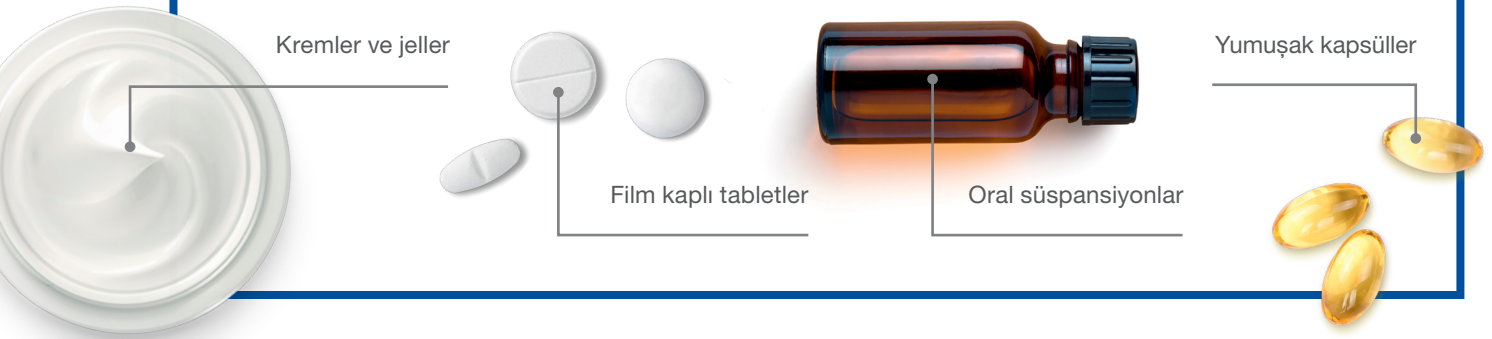
**Sadece BASF İbuprofen DC 85 W
ile basılan tabletler**



İbuprofenin uygulamaları hakkında genel bilgiler

İbuprofen esas olarak üç (3) farklı dozaj formunda kullanılır:

- **Hızlı dağılan ve etken maddenin hızlı olarak salındığı** oral film kaplı tabletler. Ortak dozlar 200, 400, 600 ve 800 mg'dır. 800 mg ibuprofen içeren yavaş salınımlı formülasyonlar da vardır.
- **Esas olarak tabletleri yutmakta güçlük çeken hastalar ve pediatrik hastalar için kullanılan** oral süspansiyonlar.
- **Topikal uygulama için kremler ve jeller**, genellikle romatizmal rahatsızlıkların veya spor yaralanmalarının tedavisinde kullanılır.



Tabletler

Önerilen türler

İbuprofen 50, İbuprofen 70, İbuprofen DC 85 W (doğrudan basım için)

Formülasyon kılavuzu

Yüksek konsantrasyonlarda magnezyum stearat, kaydırıcı olarak önerilmez. Hazır İbuprofen DC 85 W kullanımı ile doğrudan basımda yapışma azaltılır. Film kaplama için Kollicoat® IR, HPMC süspansiyonlarına kıyasla sulu çözeltilerde daha düşük bir viskoziteye sahiptir, bu da daha yüksek katı içeriğine ve daha hızlı bir kaplama işlemine imkan verir.

Süspansiyonlar

Önerilen türler

İbuprofen 25, İbuprofen 38

Formülasyon kılavuzu

Sedimentasyona karşı stabilize etmek için küçük partiküller kullanılmalıdır. Süspansiyonun pH'ı, asit aralığında olmalıdır. Böylece ibuprofen çözülmez, bu da var olan acı tadı azaltacaktır.

Kremler ve Jeller

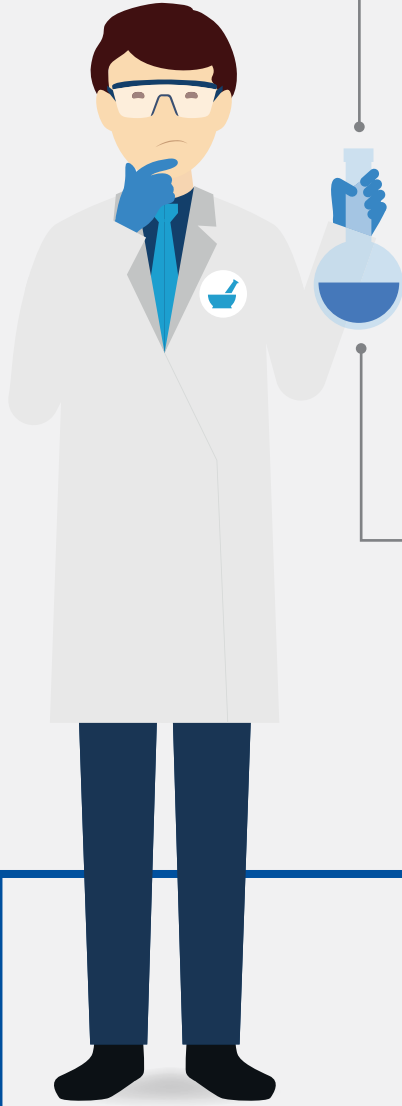
Önerilen türler

İbuprofen 25, İbuprofen 38, İbuprofen 50, İbuprofen 70

Formülasyon kılavuzu

İbuprofen, kremlerin yağ fazında çözülür, dolayısıyla partikül boyutunun etkisi yoktur. Yağlı bileşen olarak propilen glikol veya düşük moleküler ağırlıklı polietilen glikoller önerilir.

ZoomLab™ – Sanal Formülasyon Asistanınız



Örnek formülasyonlara erişme ve kendinizinkini oluşturma

ZoomLab™ Formülasyon Sihirbazı uygun yardımcı maddeleri tanımlar ve seçilen dozaj formuna, tanımlanmış hedef profile ve etken maddenin özelliklerine bağlı olarak potansiyel formülasyonları hesaplar. Örnek formülasyonlar arasında kremler, tabletler ve daha fazlası bulunur!

Nihai formülasyonunuzun biyoeşdeğerliğini değerlendirme

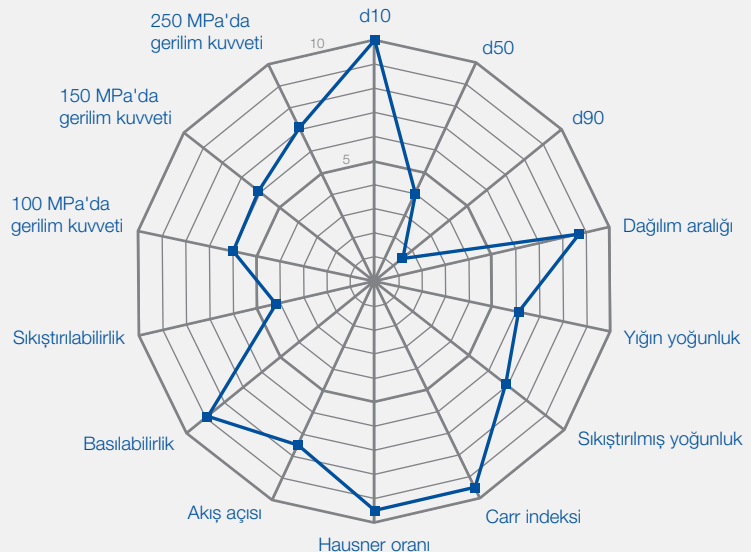
İbuprofen için bir WHO biyomuafiyet monografi mevcuttur. **ZoomLab™** çözünme modülü, disolüsyon profillerini karşılaştırarak gerekli olan farklılık ve benzerlik faktörlerini (f1, f2) hesaplamak için kullanılabilir.

API ve toz karışımının proses edilebilirliğini ve tabletlenebilirliğini tahmin etme

ZoomLab™; partikül boyutu, toz yoğunluğu, akışkanlığı ve tabletlenebilirliği ile ilgili parametreler için değerler sunar. Parametreler 0'dan 10'a kadar ölçeklenir, bir risk analizi yürütülür, sonuçlar yorumlanır ve formülasyon tavsiyesi sunulur.

Örnek: İbuprofen DC 85 W

- ✓ Doğrudan basım mümkün
- ✓ Kuru granülasyon (silindir kompaksiyon) mümkündür
- ✓ Yaş granülasyon (akışkan yataklı veya yüksek parçalayıcı granülasyon) mümkündür



Örnek formülasyonlar

200, 400, 600 ve 800 mg formları için granül üretimi

Aşağıdaki bileşenler, yüksek parçalayıcı bir karıştırıcıya yerleştirilir ve su ile granüle edilir:

İbuprofen 50	%60.1 a/a
Laktoz	%18 a/a
Mısır nişastası	%9 a/a
Kollicoat® IR*	%3.6 a/a

Su miktarı: 1 kg ibuprofen için yaklaşık 0.2 kg su. Yaş eleme (4 mm) ve akışkan yataklı bir granülatörde 60 °C'de (giriş havası) yaklaşık 30 dakika kurutma ve kuru eleme (1 mm). Toz, tablet baskı için uygun granülleri elde etmek amacıyla aşağıdaki yardımcı maddeler ile karıştırılır.

Dış faz

Avicel® PH 102	%3.6 a/a
AcDiSol	%4.8 a/a
Magnezyum stearat	%0.6 a/a
Aerosil® 200	%0.3 a/a



İbuprofen tabletleri için kaplama formülasyonları

Bileşim	Atomize süspansiyona göre oranlar [%]	Kuru filme göre oranlar [%]
Polimer		
Kollicoat® IR	16.0	64
Pigmentler		
Talk	6.0	24
Sicovit® Red 30	3.0	12
Toplam	25	100



(*HPMC 6 cp de kullanılabilir)

Büyük ölçekli işleme

Malzemeler ve yöntemler

Bileşen	Miktar	
Ibuprofen 70	%78,0	1. Eleme I (Ibuprofen 70, DiCaFos® A12)
Avicel® PH-105 (mikrokristalin selüloz)	%10,4	2. Karıştırma I (Ibuprofen 70, DiCaFos® A12)
Aerosil® 200 (kolloidal silika)	%1,0	3. Eleme II (Avicel® PH-105, Aerosil® 200, AcDiSol® SD-711)
DiCaFos® A12 (dikalsiyum fosfat anhidrus)	%3,6	4. Karıştırma II (kaydırıcı olmaksızın tüm bileşenler)
AcDiSol® SD-711 (kroskarmeloz sodyum)	%4,0	5. Eleme III (Kolliwax® S Fine)
Kolliwax® S Fine (stearik asit)	%1,0	6. Karıştırma III (tüm bileşenler)



Kullanım ve Güvenlik

Güvenli ve uygun kullanım ve imha talimatı için lütfen ilgili malzeme güvenliği bilgi formuna (MSDS) bakın. Malzeme güvenliği bilgi formları her sevkiyatla birlikte gönderilir. Ek olarak, **MyProductWorld** adresinde mevcuttur veya yerel BASF satış temsilcinizden temin edebilirsiniz.

Ürün spesifikasyonu

Ürün spesifikasyonlarının güncel versiyonunu **RegXcellence®** veya yerel BASF satış temsilcinizden temin edebilirsiniz.

Regülasyon ve Kalite

Lütfen **RegXcellence®** ve yerel satış temsilcinizden temin edebileceğiniz ilgili kalite ve regülasyon ürün bilgisi dokümanına (QRPI) başvurun. **QRPI, retest tarihleri ve saklama koşulları dahil tüm ilgili bilgileri kapsar.**

Yayınlar

Bilimsel posterleri içeren yayınlar şurada mevcuttur:

<http://pharmaceutical.basf.com/en.html>



PRD ve ürün numaraları

PRD-Numarası*	Ürün adı	Ürün numaraları	Ambalaj
30076127	İbuprofen 25	50909135 56929776	50 kg Fiber varil 0.5 kg Plastik şişe
30076128	İbuprofen 38	54888322 50909188 56929829	51.5 kg Fiber varil 50 kg Fiber varil 0.5 kg Plastik şişe
30076166	İbuprofen 50	50742398 50914488 56929882	62.8 kg Fiber varil 50 kg Fiber varil 0.5 kg Plastik şişe
30487271	İbuprofen 70	54017960 54165459	50 kg Fiber varil 0.5 kg Plastik şişe
30526498	İbuprofen DC 85 W	50192890 50192933	50 kg Fiber varil 2 kg Metal kova

* BASF'nin ticari ürün numarası.

MyProductWorld

Sanal Ürün Asistanınız



Teknik belgeleri, broşürleri ve posterleri indirin

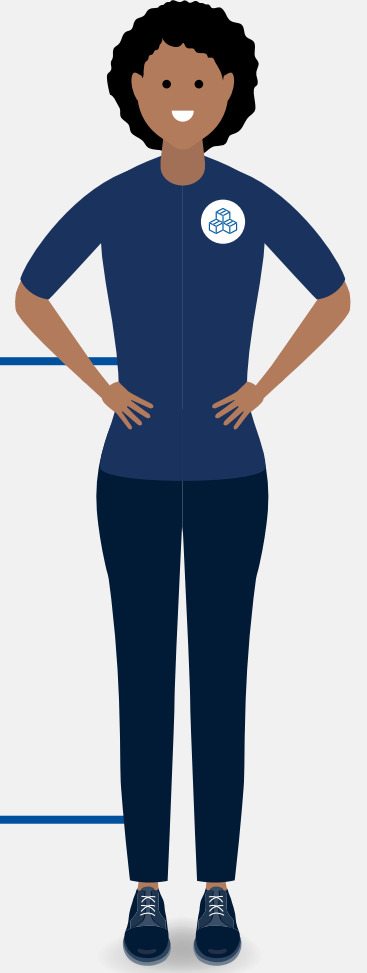


Ürün bilgilerini ve mevcut uyumluluk belgelerini arayın



Numune taleplerinizi gönderin

Daha kolay satın alma kararları vermek için ilgili tüm ürün bilgilerine erişim sağlar



RegXcellence®

Sanal Kalite ve Ruhsatlandırma Asistanınız



Standart belgeleri indirin ve özelleştirilmiş belgeler (LoA ve CEP) oluşturun.



3. parti denetim raporlarının mevcut olup olmadığını görüntüleyin, ürüne ve regülasyon konusuna göre özetleri belgeleyin.

Belge teminindeki ve regülasyona uyumlulukla ilgili sorgulamalardaki gecikmeleri ortadan kaldırır.

info-mypharma.basf.com adresinden ücretsiz kayıt olun ve bugün 7/24 Sanal İlaç Asistanınızla buluşun!

Rasemik İbuprofen Lizinat (RIBL)

Kimyasal bilgiler

İbuprofen Lizinat

Eşanlamıları

(±)-2-[4-(2-metilpropil)fenil]propionik asit lizinat
(±)-Benzenasetik asit, alfa-metil-4-(2-metilpropil) lizinat
(±)-p-İzobütilhidratropik asit lizinat
(±)-2-p-İzobütilfenilpropionik asit lizinat

Ampirik formül

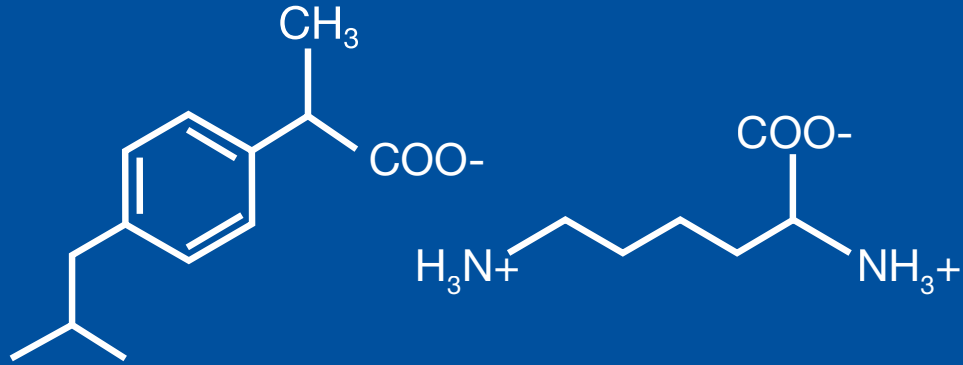
$C_{19}H_{32}N_2O_4$

Molekül ağırlığı

352.48 g/mol

Yapısal formül:

İbuprofen Lizinat



Ürün Bilgisi

PRD-Numarası	Ürün adı	Ürün numarası	Ambalaj
30081848	Rasemik İbuprofen Lizinat	56477527	25 kg, 0,1 kg (numune)

Retest süresi: Diğer belgelere bakınız:
"Ürünün Kalite ve Regülasyon Bilgi Dokümanı (Q&R PI) (regülasyon başvuruları için değil)"
RegXcellence®'da mevcuttur:
info-mypharma.basf.com
(kayıtlı erişim).

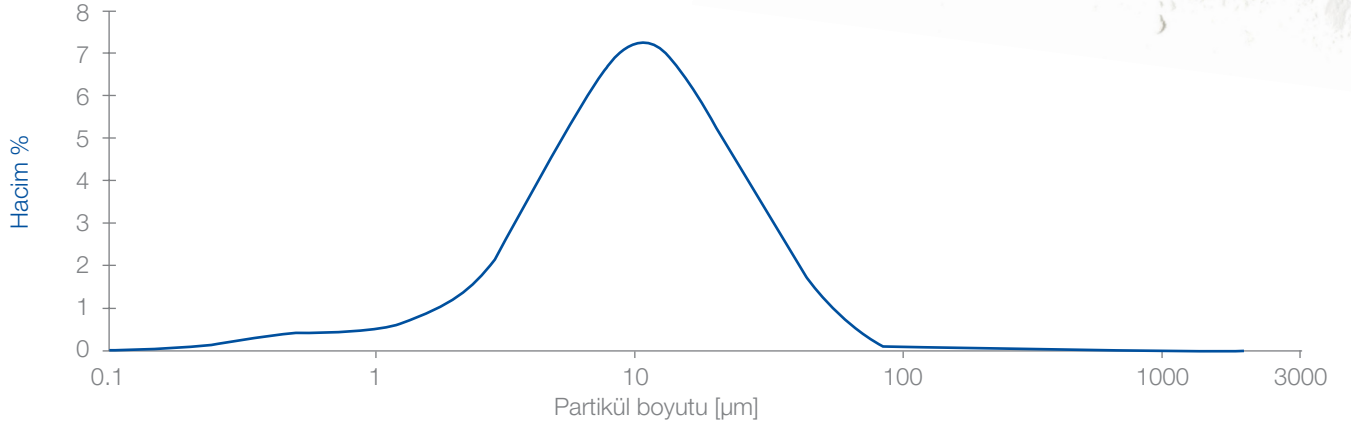
Kimyasal ve fiziksel özellikler

Beyaz veya beyazımsı, yüksek hacimli, çok küçük kristal yapıdaki toz.

Literatürde İbuprofenin (asit) distile sudaki çözünürlüğünün %0,1'den az olduğu bildirilmektedir. İbuprofen Lizinatın çözünürlüğü 1:5 veya yaklaşık %17'dir.*

Partikül karakterizasyonu

Örnek bir partikül boyutu dağılımı aşağıda gösterilmiştir. **RIBL için medyan partikül boyutu yaklaşık 10 µm'dir.**



Regülasyon durumu

Monograf yok.
E-DMF talep üzerine mevcuttur.

Spesifikasyon

Diğer belgelere bakınız: "Standart Spesifikasyon (regülasyon başvuruları için değil)" belgesine **RegXcellence®** aracılığıyla erişilebilir: (kayıtlı erişim)

<https://info-mypharma.basf.com/>





Tıbbi endikasyon

RIBL terimi, Rasemik İbuprofen Lizinat'ın kısaltmasıdır. Rasemik, ibuprofen ilaç etken maddesinin ve lizin anyonunun her ikisinin de rasemik bileşikler olduğunu belirtir. RIBL, bağırsak yolundan daha hızlı emilmesi ve doruk plazma düzeylerine ve $t_{maksimum}$ 'a daha hızlı bir şekilde ulaşması bakımından, genel olarak ibuprofen olarak adlandırılan yaygın ibuprofen asitten farklıdır.¹⁻² Emilimden sonra, RIBL saf ibuprofen asit formunda mevcuttur ve bu nedenle ibuprofen gibi kullanılmalıdır.

İbuprofen, steroid olmayan anti-inflamatuar ilaçlar (NSAID'ler) sınıfına ait bir kiral propiyonik asit türevidir. Analjezik, antipiretik ve anti-inflamatuar etkileri nedeniyle ibuprofen, romatoid artrit, osteoartrit, hafif ila orta şiddette ağrı, dismenore, baş ağrısı ve ateş gibi inflamasyon durumlarının tedavisinde kullanılır.³

RIBL için olağan dozaj aralıkları, 340 mg ve 680 mg içeren tabletlerdir. RIBL henüz ABD'de onaylanmamıştır.



Farmakokinetik

RIBL, sindirim sisteminde kolayca ve hızla emilir.¹⁻² Serbest asidin doruk plazma düzeyine 30 ila 60 dakika içinde ulaşılır (serbest asit ibuprofen için $t_{maksimum}$ dozaj formuna bağlı olarak 60 ila 120 dakika arasında ölçülmüştür).^{1, 6} Absorpsiyondan sonra RIBL ve serbest asit arasında hiçbir fark yoktur.





Farmakoloji

Farmakolojik bakış açısından, RIBL ve serbest ibuprofen asit arasında hiçbir fark yoktur çünkü aktif form RIBL tuzu değil, serbest asittir.

İbuprofenin etki mekanizması tam olarak anlaşılamamasına rağmen, hücresel membrandaki araşidonik asitten prostaglandinlerin (PG'ler) biyosentezinden sorumlu olan siklooksijenaz (COX) enziminin geri dönüşümlü inhibisyonununundan kaynaklandığı düşünülmektedir.⁴

Prostaglandinler çeşitli dokularda dağılır ve diğer özelliklerin yanı sıra düz kaslar üzerinde güçlü bir etkiye sahiptir. İnflamasyon uyarıcısı varlığında veya kan dolaşımı bozuklukları durumunda, PG'ler artan miktarlarda sentezlenir ve dokuları histamin ve kininler gibi diğer ajanların etkisine karşı duyarlı hale getirir. Bunun sonucunda ağrı ve iltihaplanma gibi belirtiler ortaya çıkar. Ateş sıklığı, PG'lerin hipotalamustaki ısı düzenleme merkezi üzerindeki etkisiyle artar. Burada, vücut sıcaklığı normal değeri olan 37 °C'ye yükseltilir.⁵

Referanslar

- ¹ Martin, W. ve diğerleri, "Pharmacokinetics and Absolute Bioavailability of Ibuprofen After Oral Administration of Ibuprofen Lysine in Man," *Biopharmaceutics & Drug Disposition*, 11(3): 265-278, 1990.
- ² Hermann, T. W. ve diğerleri, "Bioavailability of Racemic Ibuprofen and its Lysinate from Suppositories in Rabbits," *Journal of Pharmaceutical Sciences*, 82(11):1102-1111, 1993.
- ³ ABD Gıda ve İlaç Dairesi "Ibuprofen Drug Facts Label" 6 Nisan 2016'da Revize Edildi.
- ⁴ Neupert, W. ve diğerleri, "Effects of Ibuprofen Enantiomers and Its Coenzyme a Thioester on Human Prostaglandin Endoperoxide Synthases," *British Journal of Pharmacology*, 122:487-92, 1997.
- ⁵ Ricciotti, E. ve G. A. FitzGerald, "Prostaglandins and Inflammation," *Arteriosclerosis Thrombosis, and Vascular Biology*, 31(5): 986-1000, 2011.
- ⁶ Davies, N. M., "Clinical Pharmacokinetics of Ibuprofen," *Clinical Pharmacokinetics*, 34:101-154, 1998.

İbuprofen Sodyum Dihidrat

Kimyasal bilgiler

İbuprofen Sodyum Dihidrat

Kimyasal adı 2-(4-izobütilfenil)-propiyonat sodyum dihidrat

CAS Numarası 31121-93-4

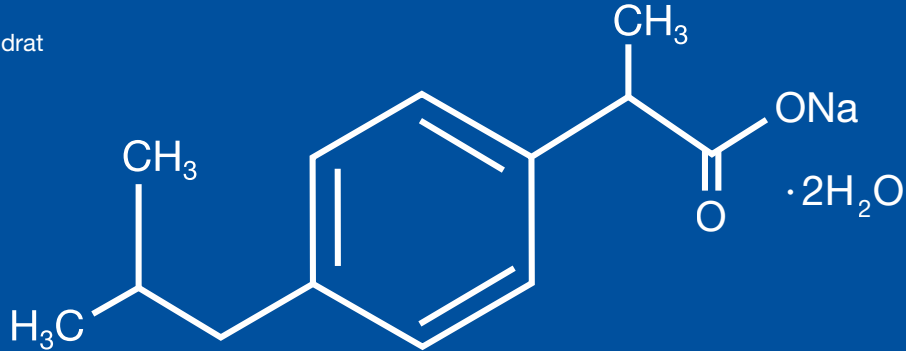
Ampirik formül $C_{13}H_{17}O_2Na \times 2 H_2O$

Molekül ağırlığı 228.26 + 36.03 g/mol

Görünüm Beyaz veya beyazımsı toz

Yapısal formül:

İbuprofen Sodyum Dihidrat



Ürün bilgisi

PRD-Numarası	Ürün adı	Ürün numarası	Ambalaj
30260589	İbuprofen Sodyum Dihidrat	51224063	50 kg, 5 kg 0.5 kg (örnek)

Retest süresi: Diğer belgelere bakınız:
“Ürünün Kalite ve Regülasyon Bilgi Dokümanı (Q&R PI) (regülasyon başvuruları için değil)” **RegXcellence®**’da mevcuttur:
info-mypharma.basf.com
(kayıtlı erişim).





Depolama

İbuprofen Sodyum Dihidrat, orijinal, sıkıca kapatılmış kaptaki saklanmalıdır. Ortam sıcaklığında iyi havalandırılan bir odaya yerleştirilmeli ve ışıktan korunmalıdır.

İbuprofen Sodyum Dihidratın retest süresi, orijinal, açılmamış kabında ve önerilerimize göre saklanan ham madde için 60 aydır.

Regülasyon durumu

Şu anda, ana farmakopelerde (USP, Ph. Eur. ve JP) İbuprofen Sodyum Dihidratı tanımlayan bir monograf bulunmamaktadır.

E-DMF ve US-DMF'nin her ikisi de **RegXcellence®**'da mevcuttur.

Spesifikasyon

Diğer belgelere bakınız: "Standart Spesifikasyon (regülasyon başvuruları için değil)" belgesine **RegXcellence®**(kayıtlı erişim) aracılığıyla erişilebilir.

<https://info-mypharma.basf.com/>





Farmakokinetik

Literatüre göre, ibuprofen sodyum dihidrat in vitro olarak daha hızlı çözünür ve kan plazmasına konvansiyonel ibuprofenden daha hızlı emilir, buna karşın iki etken maddenin de tolere edilebilirliği ve güvenlik profilleri karşılaştırılabilir.³

Konvansiyonel ibuprofene karşı ibuprofen sodyum dihidratın çözünmesi, plazma farmakokinetiği ve güvenliğine ilişkin bir araştırmada, aşağıdaki sonuçlar rapor edilmiştir:³

- İbuprofen sodyum dihidrat, konvansiyonel ibuprofene kıyasla pH 1,2, 3,5 ve 7,2'de önemli ölçüde daha hızlı çözünmüştür.
- İbuprofen sodyum dihidrat $t_{maksimum}$ 'a konvansiyonel ibuprofenden önemli ölçüde daha erken ulaşmıştır.
- İbuprofen sodyum dihidrat, konvansiyonel ibuprofen ile karşılaştırıldığında önemli ölçüde daha yüksek $c_{maksimum}$ göstermiştir.
- İbuprofen sodyum dihidrat, konvansiyonel ibuprofen ile karşılaştırıldığında önemli ölçüde daha yüksek ortalama plazma konsantrasyonu (dozdan 10 dakika sonra) ile karakterize edilmiştir.

$t_{maksimum}$ bir ilacın maksimum plazma konsantrasyonuna ulaşılması için gerekli süredir; bu, ilacın başlangıçtaki etkisiyle ilgilidir. Genel olarak, $t_{maksimum}$ 'a erken ulaşmak analjezik tedavi için büyük avantajdır.

Literatüre göre, ibuprofen sodyum dihidrat ile tedavi edilen hastalarda ağrının dindirilmesinin ilk belirtileri önemli ölçüde daha erken ortaya çıktı ve ağrı şiddeti, konvansiyonel ibuprofen için 57 dakika sonra yarıya düşerken, ibuprofen sodyum dihidrat için bu süre 30 dakika olarak belirlenmiştir. Özetle, ibuprofen sodyum dihidrat, konvansiyonel ibuprofen ile karşılaştırıldığında, oral uygulamadan sonraki ilk saat içinde daha hızlı ve daha etkili ağrı rahatlama sağlanmaktadır.⁴





Farmakoloji

Etki mekanizması tam olarak anlaşılamamasına rağmen, hücresel membrandaki araşidonik asitten prostaglandinlerin (PG'ler) biyosentezinden sorumlu olan siklooksijenaz (COX) enziminin geri dönüşümlü inhibisyonunun kaynaklandığı düşünülmektedir.¹

Prostaglandinler çeşitli dokularda dağılır ve diğer özelliklerinin yanı sıra düz kaslar üzerinde güçlü bir etkiye sahiptir. İnflamasyon uyarıcısı varlığında veya kan dolaşımı bozuklukları durumunda, PG'ler artan miktarlarda sentezlenir ve dokuları histamin ve kininler gibi diğer ajanların etkisine karşı duyarlı hale getirir. Bunun sonucunda ağrı ve iltihaplanma gibi belirtiler ortaya çıkar. Ateş, PG'lerin hipotalamustaki ısı düzenleme merkezi üzerindeki etkisiyle meydana gelir. Burada, vücut sıcaklığı normal değeri olan 37 °C'ye yükseltilir.²

Referanslar

- ¹ Neupert, W. ve diğerleri, "Effects of Ibuprofen Enantiomers and Its Coenzyme a Thioester on Human Prostaglandin Endoperoxide Synthases," British Journal of Pharmacology, 122:487-92, 1997.
- ² Ricciotti, E. ve G. A. FitzGerald, "Prostaglandins and Inflammation," Arteriosclerosis Thrombosis, and Vascular Biology, 31(5): 986-1000, 2011.
- ³ Soergel, F. ve diğerleri "Pharmacokinetics of Ibuprofen Sodium Dihydrate and Gastrointestinal Tolerability of Short-Term Treatment with a Novel, Rapidly Absorbed Formulation," International Journal of Clinical Pharmacology and Therapeutics. 43(3):140-149, 2005.
- ⁴ Schleier, P. ve diğerleri, "Ibuprofen Sodium Dihydrate, an Ibuprofen Formulation with Improved Absorption Characteristics, Provides Faster and Greater Pain Relief than Ibuprofen Acid," International Journal of Clinical Pharmacology and Therapeutics. 45(2):89-97, 2007.





We create chemistry

Daha fazla bilgi için bizi

www.pharma.basf.com adresinden ziyaret edin.

Numune talepleri için bize

pharma-solutions@basf.com adresinden ulaşın.



Sanal İlaç Asistanınızla tanışın!

ZoomLab™, RegXcellence® ve MyProductWorld, ilaç formülasyonlarını optimize etmek, kalite ve regülasyona uyumluluğu konularında yönlendirmeler yapmak ve ham maddeleri araştırmak için sunulan etkileşimli rehberlerinizdir.

Daha fazla bilgi edinin ve <https://info-mypharma.basf.com/> adresinden kaydolun

Inspiring Medicines for Better Lives

Bu belge veya burada sağlanan herhangi bir bilgi, BASF'nin yasal olarak bağlayıcı bir yükümlülüğünü oluşturmaz ve iyi niyetle hazırlanmıştır ve düzenlenme tarihi itibarıyla doğru olduğu inandırılmaktadır. Aksi açıkça yazılı olarak bir tedarik sözleşmesinde veya BASF ile aranızdaki diğer yazılı sözleşmede kararlaştırılmadıkça:

- Geçerli yasalar tarafından yasaklanmayan en geniş ölçüde, BASF, HERHANGİ BİR ZİMNİ TEMİNAT, TİCARETE ELVERİŞLİLİK, ÖZEL BİR AMACA UYGUNLUK TATMINKÂR KALİTE, İHLAL ETMEMEYE İLİŞKİN BEYAN VEYA KOŞULLAR VE TÜZÜK, ÖNCEKİ SÖZLEŞMELERE GÖRE YORUM VEYA TİCARİ KULLANIMDAN KAYNAKLANAN TÜM BEYAN, TEMİNAT, KOŞUL VEYA GARANTİLER DAHİL OLMAK ÜZERE ALENİ VEYA ZİMNİ, YAZILI VEYA SÖZLÜ, DOLAYISIYLA VEYA KANUN GEREĞİ TÜM DİĞER HER TÜR BEYAN, TEMİNAT, KOŞUL VEYA GARANTİLERE İLİŞKİN SORUMLULUĞUNU AÇIKÇA REDDEDER ve BASF BU BELGE İLE VEYA BU BELGEDEN VEYA BU BELGEDE YER ALAN HERHANGİ BİR BİLGİDEN KAYNAKLANAN VEYA BUNLARLA BAĞLANTILI OLAN HERHANGİ BİR SORUMLULUĞU, sınırlama olmaksızın (i) BASF'in münhasır ihmali nedeniyle meydana gelmesi kaydıyla ölüm veya kişisel yaralanma, (ii) BASF'in kasıtlı suiistimali, dolandırıcılık veya sahte beyanı veya (iii) geçerli yasalar uyarınca BASF'in sorumluluğu hariç tutmasının veya reddetmesinin yasadışı olacağı tüm konular hariç olmak üzere bununla ilişkili olan veya bundan kaynaklanan dolaysız, dolaylı, özel veya cezai hasarlardan ötürü herhangi bir sorumluluk dahil olmak üzere; AÇIKÇA HARIÇ BIRAKIR VE REDDEDER;
- Burada sağlanan herhangi bir bilgi, münhasıran BASF'in takdirine bağlı olarak herhangi bir zamanda değiştirilebilir ve ne bu belgeye ne de burada verilen bilgilere, kendi denetim ve değerlendirmelerinizi yapmanız gerekebilecek herhangi bir veya tüm yükümlülüklerinizi karşılamak için güvenilemez.
- BASF, geçerli yasalar gerektirmedikçe, bu belgeyi ve burada sağlanan herhangi bir bilgiyi herhangi bir yükümlülüğü reddeder ve otomatik olarak güncellemez ve
- Kullanıcı, kullanıcının bu belgenin en güncel sürümünü uygun şekilde BASF'dan aldığını onaylamaktan sorumludur.

RegXcellence®, BASF'in tescilli ticari markasıdır. © 2021 BASF Corporation. Tüm Hakları Saklıdır.

Daha fazla sorunuz veya ek desteğe ihtiyacınız varsa, lütfen BASF temsilcinizle iletişime geçin.