

اللصاقات الجلدية

Transdermal Patches

2024-2023

البلاستر الطبي Medicated plasters

- محضرات مرنة مكونة من مادة دوائية أو أكثر, معدة للتطبيق على الجلد. تحافظ على بقاء المادة الدوائية على تماس مع الجلد بحيث يتم الامتصاص ببطء أو تعمل كطبقة وقاية أو للمساعدة على حدوث إماهة الطبقة المتقرنة.
- تتألف من:
 1. طبقة لاصقة وتحتوي على المادة الفعالة بشكل طبقة متجانسة موضوعة على داعم مناسب مصنوع من مواد طبيعية أو صناعية.
 2. تُغطى الطبقة اللاصقة بطبقة حماية اللاصق liner protective تنزع قبل تطبيق البلاستر للجلد.
- تتوافر البلاستر الطبية بقياسات مختلفة حسب مكان وهدف الاستخدام حيث تطبق على الجلد بالضغط اللطيف بالاصابع.

Voltarol[®]

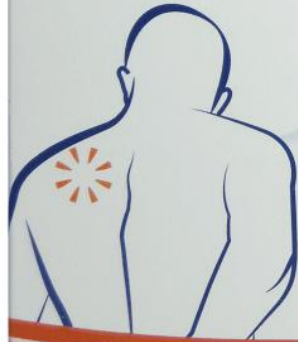
140 mg Medicated Plaster

Diclofenac sodium

For muscle, neck & shoulder pain

Anti-inflammatory • Relieves pain • Cools skin

gsk



2 plasters



Transdermal patches اللصاقات الجلدية

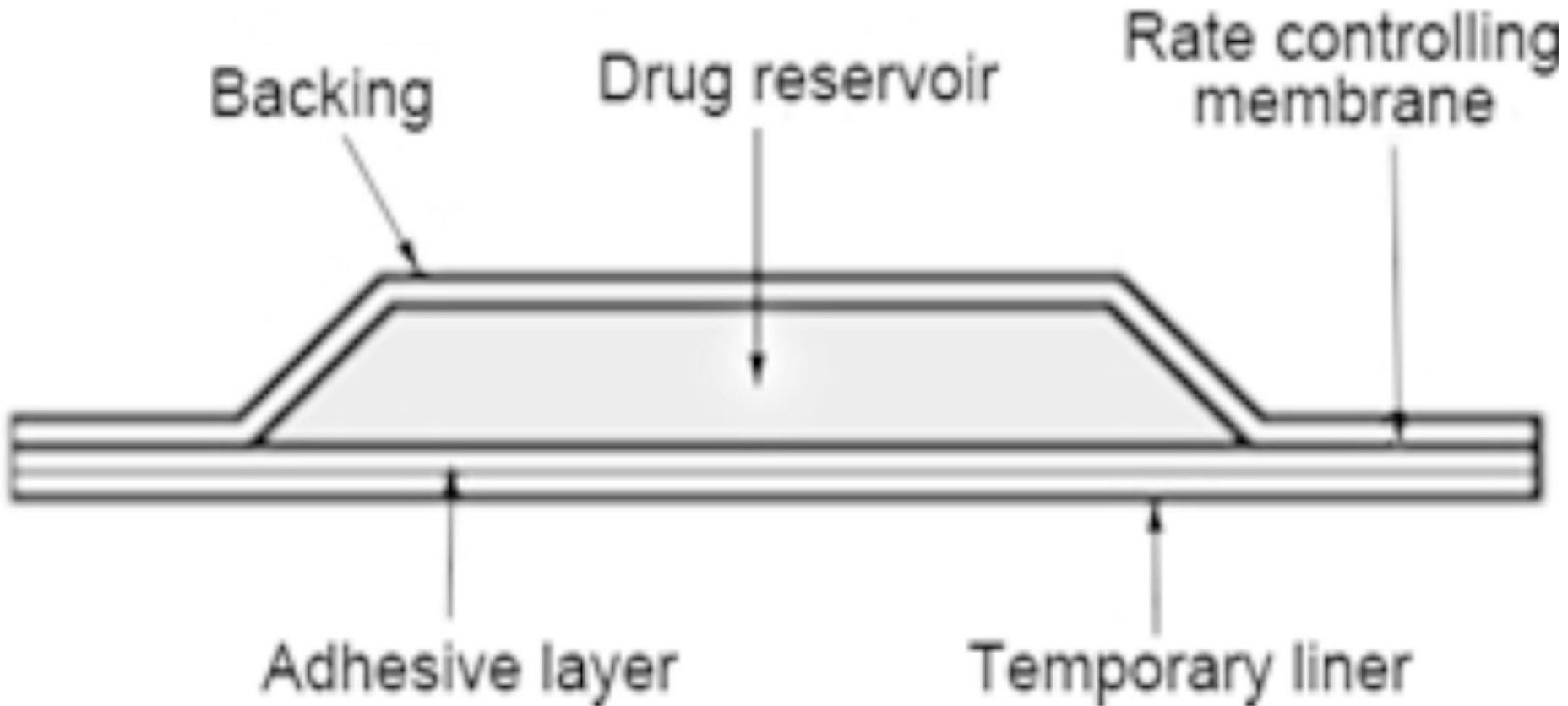
- مستحضرات صيدلانية مرنة تختلف في أحجامها وتحتوي على مادة فعالة أو أكثر.
- معدة للتطبيق على الجلد السليم للوصول إلى التأثير الجهازى بعد عبور الحاجز الجلدي.
- يتألف المحضر من المادة الفعالة مع السواغات كالمواد المساعدة على تحسين الانحلال أو الثباتية أو المعدلة للتححرر أو المحسنة للنفوذ

مميزات اللصاقات

- 1- تجنب التغيرات في درجة الـ pH المشاهدة في الطريق الهضمي
- 2- تجنب العبور الكبدي الاوّل
- 3- يمكن إزالة اللصاقات بسهولة وسرعة في حالات التأثيرات الضارة أو التحسس الدوائي
- 4- التزام المريض بها جيد

لكن بسبب الخواص الحاجزية للجلد يوجد عدد قليل من الجزيئات الدوائية التي تمتلك خواصاً فيزيوكيميائية وعلاجية مناسبة للإيتاء المديد عبر الجلد.

أقسام اللصاقة الجلدية



1) الطبقة الواقية Liner

- تحمي اللصاقة خلال التخزين من تسرب المادة الفعالة وتحمي من تأثير العوامل الخارجية
- تصنع عادة من البولييمرات مثل البولي إيثيلين فينيل اسيتات أو رقائق الألمنيوم وذلك حسب طبيعة اللاصق الذي تغطيه.
- تنزع قبل التطبيق ويجب أن تُزال بسهولة ولكن أيضاً يجب ان تكون مرتبطة بإحكام كافي لتجنب الإزالة العرضية.
- يجب أن تكون محكمة الإغلاق للوقاية من ضياع مكونات المواد الطيارة مثل الإيثانول.

Adhesive الطبقة اللاصقة (2)

تستعمل اللواصق الحساسة للضغط مثل **polysiloxane or polyisobutylene ,acrylates**

يجب أن تلبى الشروط التالية:

- الإلتصاق بالجلد طول فترة الاستعمال
- يجب إلا تسبب التهيج والحساسية
- أن تتوافق مع الدواء والسواغات الأخرى
- السماح بإزالة اللاصقة بدون ألم وبدون ترك بقايا من اللاصق على سطح الجلد.

3) الطبقة الداعمة Backing

- القسم الخارجي من اللصاقة.
- تحمي اللصاقة من العوامل البيئية الخارجية وتمنع فقدان أو تبخر المادة الدوائية.
- في اللصاقات الصغيرة والمستخدمة لوقت قصير نسبياً يمكن اختيار الطبقات الداعمة المحكمة الإغلاق التي تؤمن بذلك إمالة طبقات الجلد تحتها مما يحسن الإختراقية
- من المواد: **البولي إيثيلين أو أفلام البولي استر.**
- في اللصاقات الكبيرة الحجم والمستعملة لفترة أطول يفضل استخدام مواد تسمح بنفوذ الأكسجين والبخار **مثل البولي فينيل كلوريد.**
- كما يجب أن تكون الطبقة الداعمة مرنة بشكل كاف لتسمح بتحريك اللصاقة عند تحريك الجلد. تجمع الطبقة الداعمة المثالية بين المرونة العالية والقابلية الجيدة لتمرير الأكسجين والماء (عدم مرور الماء بالإطلاق يجعلها قابلة للسقوط).

4) القالب / المستودع Reservoir / Matrix

يُحضر عادة بحل الدواء والبوليمرات في مذيب شائع قبل إضافتها إلى سواغات أخرى مثل **الملدنات**.

يمكن تعديل اللزوجة وبالتالي ضبط انتشار الدواء عبر القالب إلى اللاصق وبعد ذلك إلى سطح الجلد.

من مكونات القالب **former Matrix**

1. البولي ايتلين غليكول المتصالب: تنتج وتشكل هلاميات قادرة على تحرير المادة الفعالة

2. قوالب حمض الأكريليك

Eudragit RL PM, Eudragit S-100

Membran الغشاء (5)

- ينظم سرعة تحرر المادة الفعالة من المخزن
- لا يتواجد في كل الأنماط.
- يجب أن يكون متوافقاً مع الدواء, غير سام, ثابت ومرن.
- يمكن استعمال العديد من البوليمرات لهذا الغرض
مثل البولي إيثيلين فينيل اسيتات.

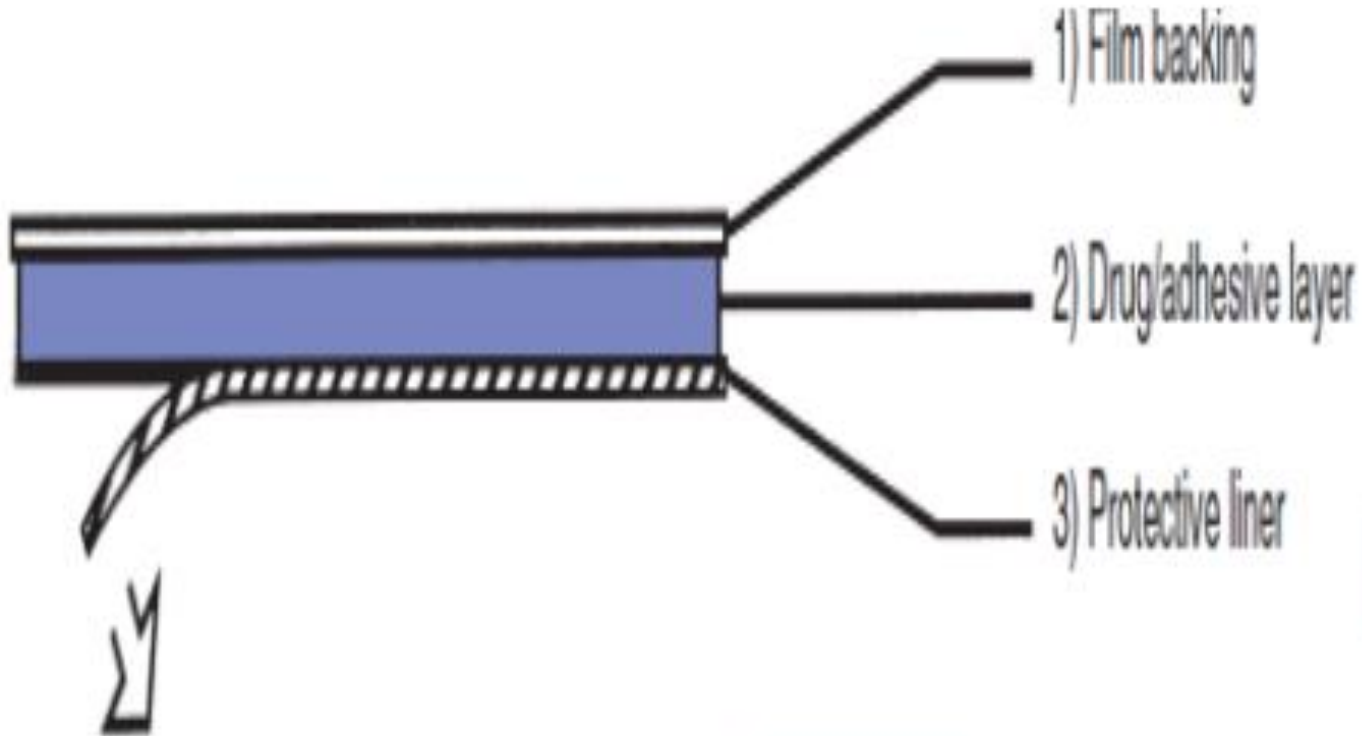
أنماط اللصاقات الجلدية

1) الأنظمة اللاصقة Adhesive System

- تستعمل لإيتاء النيكوتين والاستراديول والنترولوغليسرين
- يميل هذا النمط ليكون رقيق وأكثر مرونة من الأنماط الأخرى.
- وكما مع كل اللصاقات يمكن زيادة الجرعات الدوائية اليومية عن طريق زيادة مساحة سطح اللصاقة.
- يمكن تصميم هذا النوع لإيتاء أدوية خلال يوم واحد (النيكوتين) أو لتصل إلى 7 أيام (استراديول).
- تهدف لإيتاء الدواء بمعدل ثابت خلال مدة الاستعمال (الرتبة صفر).
- لكن عملياً ينخفض تركيز الدواء في اللصاقة مع الوقت ويتغير بالتالي مدروج التركيز بين اللصاقة والجلد مما قد يقلل الاختراق. لكن هذا قد يكون هذا مهماً أحياناً.
- تستعمل عادة للأدوية ذات الأوزان الجزيئية المنخفضة.

Adhesive system الأنظمة اللاصقة

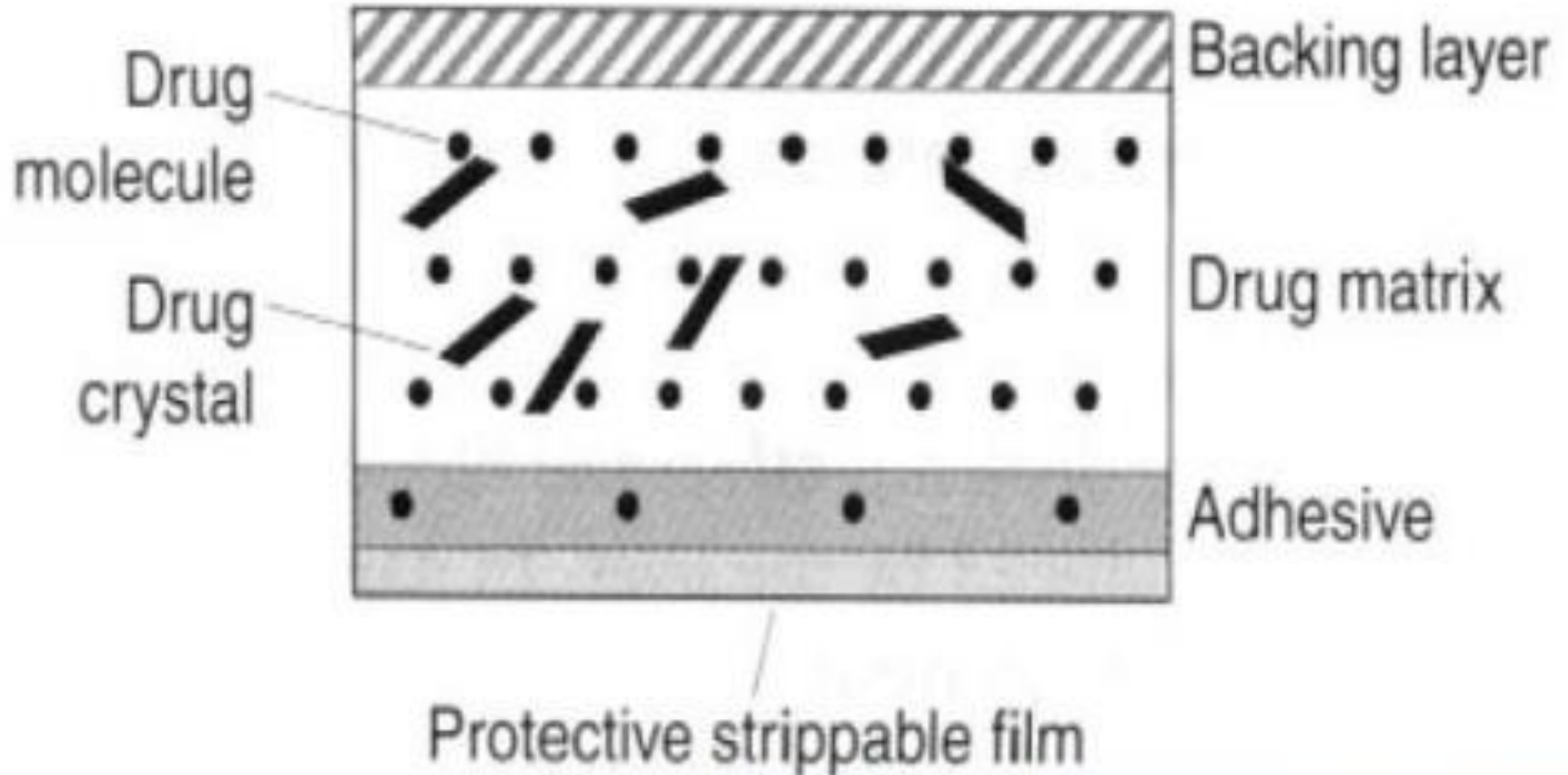
تعتبر أبسط الأنماط وأكثرها انتشارا حيث تحتوي المادة اللاصقة على المادة الفعالة (تتكون من دواء منحل أو مبعثر في اللاصق)



2) أنظمة القالب Matrix System

- لزيادة المحتوى الدوائي حيث يتواجد الدواء بشكل محلول أو معلق ضمن قالب بوليمري صلب.
- من البوليمرات البولي فينيل أسيتات والبولي فينيل بيروليدين
- قد تضاف بعض المواد الأخرى كالملدنة (غليسيرول).
- كما يمكن استعمال الجل كقالب.
- الدواء سيتوزع أولاً في القالب ثم ينتشر في عبر الطبقة اللاصقة.
- الطبقة اللاصقة قد تحوي المادة الفعالة المنحلة وتساعد على الالتصاق على الجلد
- طبقة حماية قابلة للنزع

Matrix System أنظمة القالب



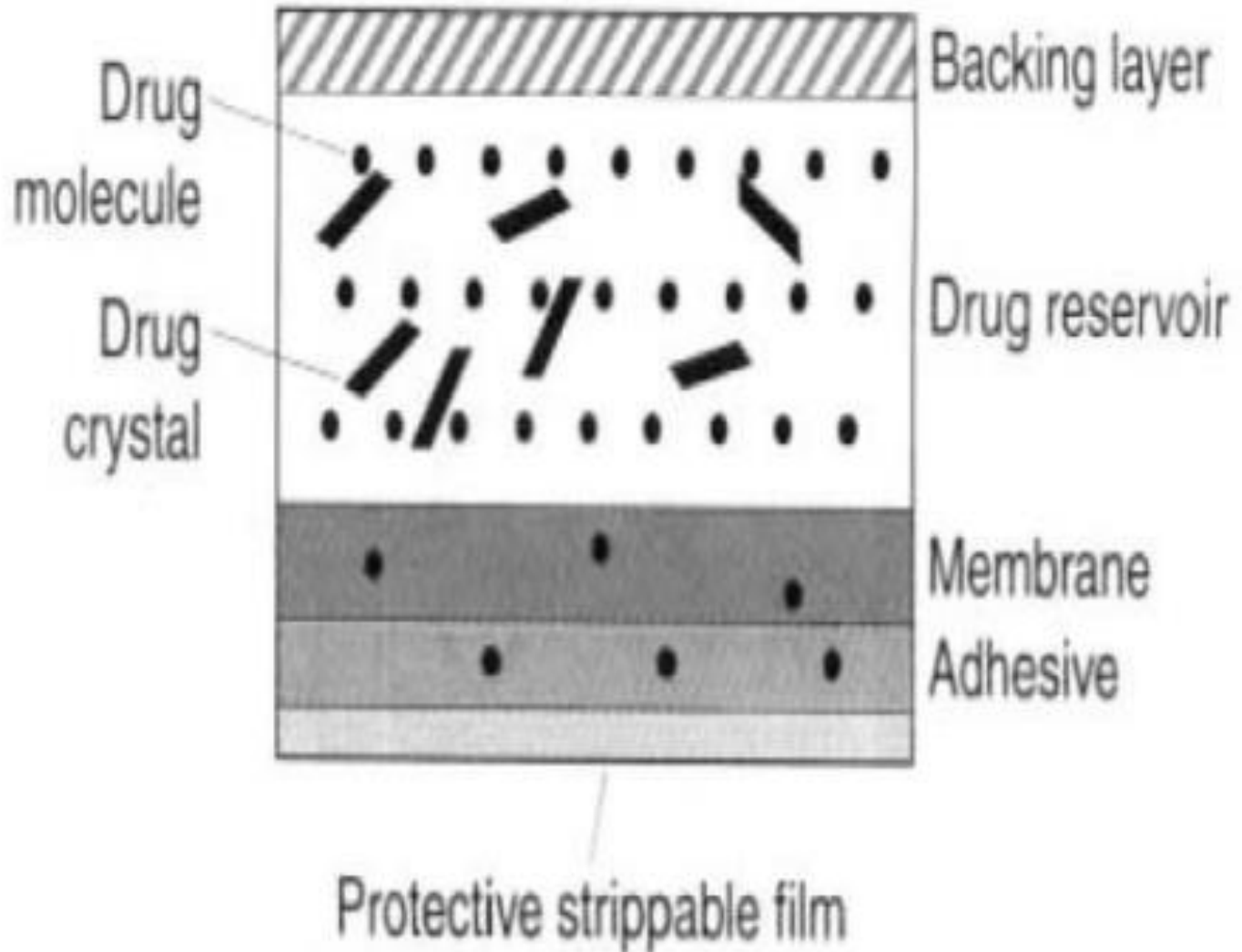
(3) الأنظمة ذات الأغشية المحددة

Limiting Rate System Membrane المخزن reservoir

- هي الأكثر تعقيداً حيث يوجد الدواء ضمن مخزن صغير ويضبط غشاء نصف نفوذ تحته تحرر الدواء.
- يمكن أن يكون المستودع سائل أو هلاماً وهو الأكثر انتشاراً.
- يساعد في تحميل جرعات عالية من الدواء.
- يلعب الغشاء دور المنظم لتحرر المادة الفعالة وقد يكون:
 - بدون مسام: يتحرر الدواء بالنفوذ فيعتمد معدل المرور على كل من ثخانة الغشاء وانهلال الدواء في الغشاء
 - ذو مسام دقيقة مملوء بسائل معين: تعبره المادة الدوائية

الأنظمة ذات الأغشية المحددة

Limiting Rate System Membrane



مراقبة اللصاقات

1- فحص تجانس المحتوى

- يجرى على 10 لصاقات
- يجب أن يكون متوسط المحتوى للعينات المدروسة بين 90-110%
- يجب ألا يتجاوز محتوى أي عينة 75-125% من الكمية المعلن عنها

2. فحص الانحلال

طريقة القرص

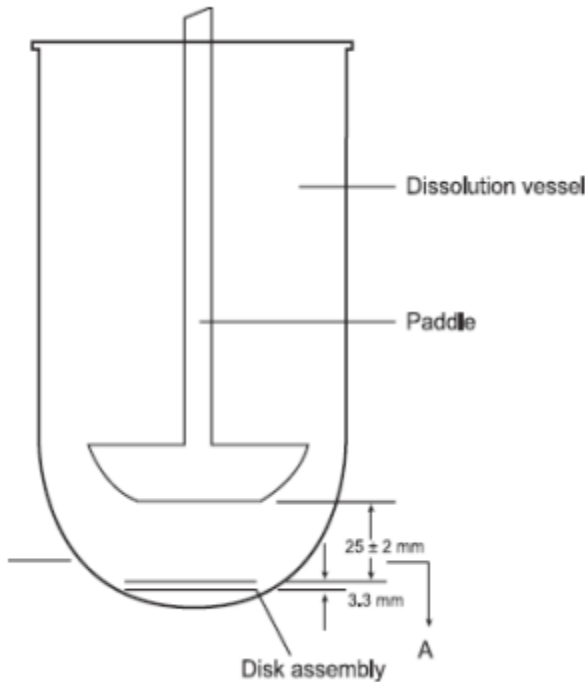
DISK ASSEMBLY METHOD

تجمع بين المجذاف paddle بالإضافة

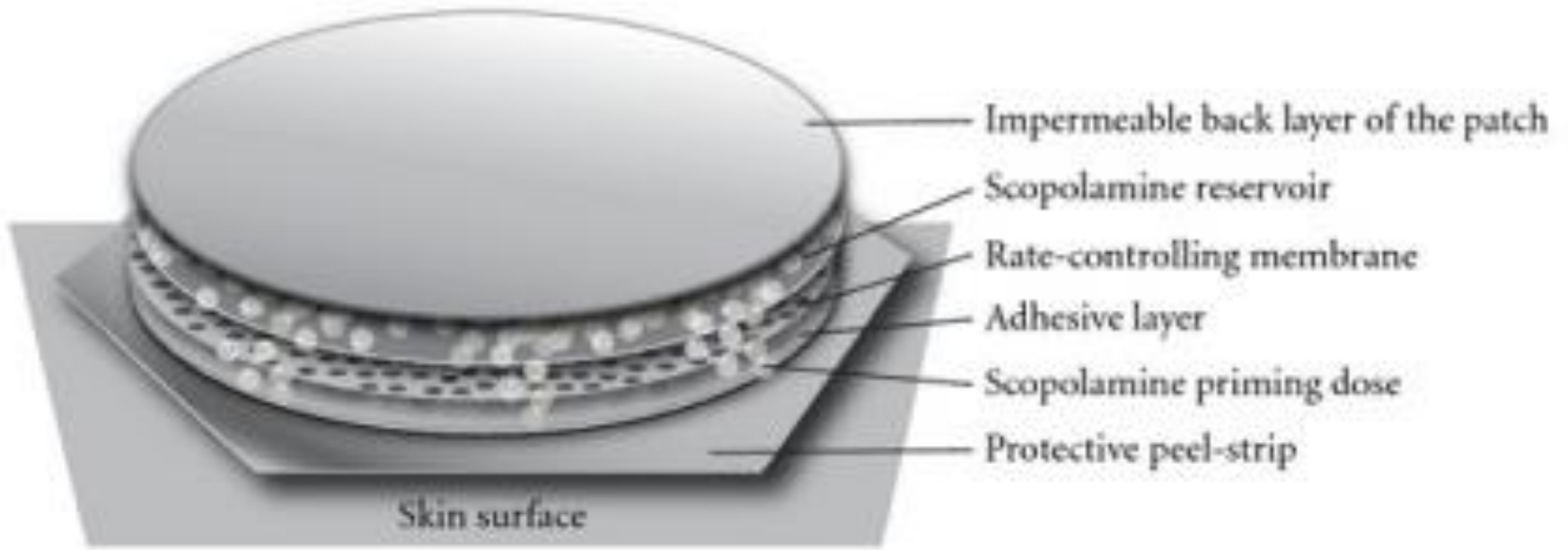
إلى شبكة من الستانلس ستيل ذات أبعاد 125 μm

توضع اللصاقة على الشبكة بحيث يكون

سطح التحرر باتجاه الأعلى



أمثلة عن اللصاقات الجلدية



لصاقة السكوبولامين

أول لصاقة حازت على موافقة الـ
 FDA وطرحت بالسوق عام 1979
 تطبق خلف الأذن
 تملك غشاء ضابط للسرعة
 يتم تحرر الدواء من اللاصق التماسي
 لإشباع مواقع الارتباط في الطبقة
 المتقرنة

NDC 0067-4346-04
 NSN 6505-01-456-2380

TRANSDERM SCOP (scopolamine) TRANSDERMAL SYSTEM, 1 mg/3 days

Formulated delivery of approximately 1 mg over three days



**MOTION SICKNESS
 & POST-OPERATIVE
 NAUSEA & VOMITING
 PREVENTION
 TRANSDERMAL SYSTEMS**

4 Transdermal Systems

Rx ONLY

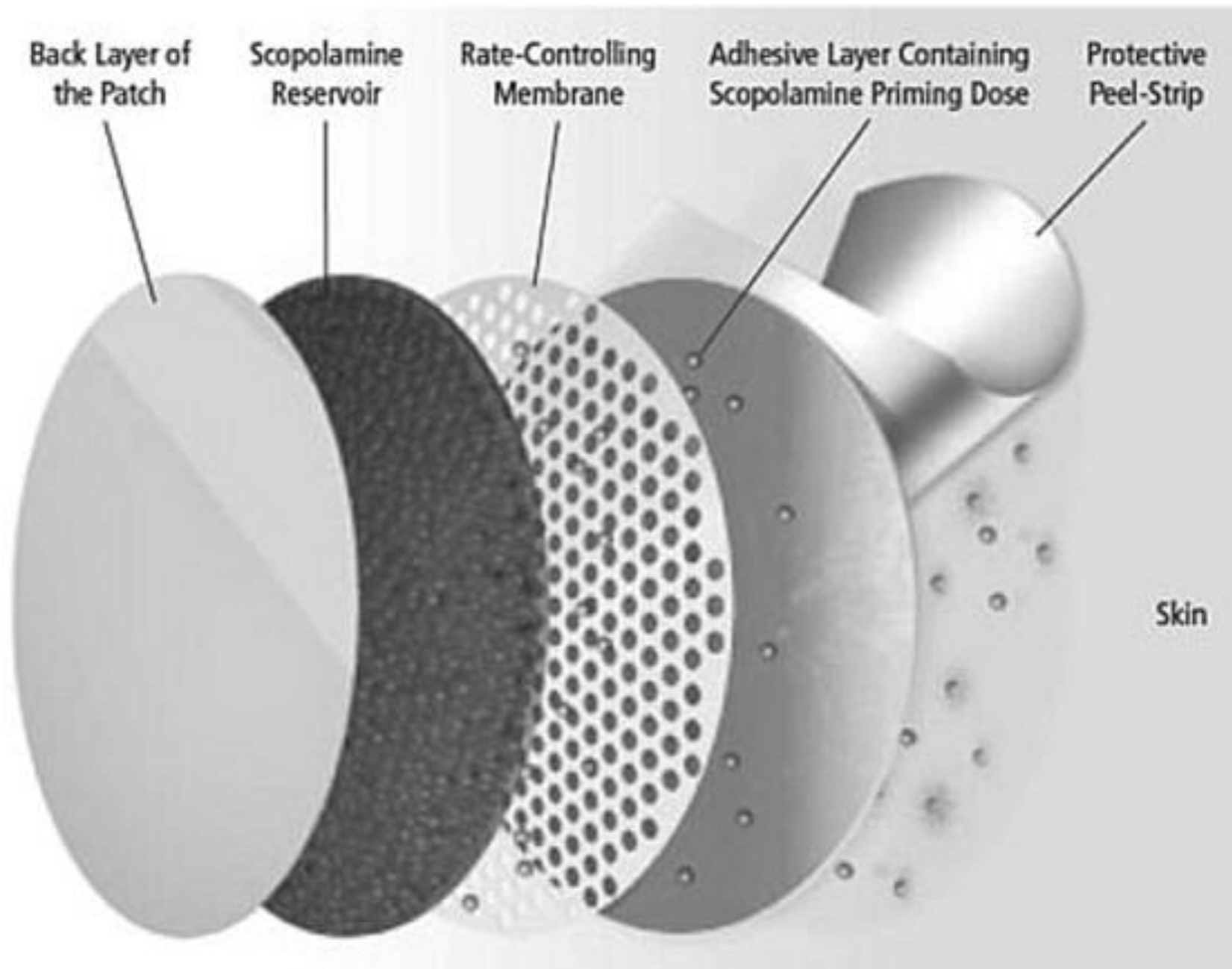


TABLE 11.1 EXAMPLES OF TRANSDERMAL DRUG DELIVERY SYSTEMS (40–44, 47–51)

THERAPEUTIC AGENT	TDDS	DESIGN, CONTENTS	COMMENTS
Clonidine	Catapres-TTS (Boehringer Ingelheim)	Four-layer patch: (a) backing of pigmented polyester film; (b) reservoir of clonidine, mineral oil, polyisobutylene, colloidal silicon dioxide; (c) microporous polypropylene membrane—controlling rate of delivery; (d) adhesive formulation of agents	Transdermal therapeutic system to deliver therapeutic dose of antihypertensive drug at constant rate for 7 days. TDDS generally applied to hairless or shaven area of upper arm or torso
Estradiol	Estraderm (Novartis)	Four-layer patch: (a) transparent polyester film; (b) reservoir of estradiol, alcohol gelled with hydroxypropyl cellulose; (c) ethylene–vinyl acetate copolymer membrane; (d) adhesive formulation of light mineral oil, polyisobutylene	Transdermal system to release 17 β -estradiol continuously. Patch is generally applied to trunk, including abdomen and buttocks, alternating sites, twice weekly over a 3-week cycle with dosage frequency adjusted as required

NDC 0781-7133-54

Estradiol Transdermal System

0.05 mg/day

Rx Only

Contents: Each 12.5 cm² system contains 3.8 mg estradiol USP to provide 0.05 mg of estradiol per day. The inactive components are acrylate copolymer adhesive, fatty acid esters, and polyethylene backing.

FOR TRANSDERMAL USE ONLY

**KEEP THIS AND ALL DRUGS
OUT OF THE REACH OF CHILDREN.**

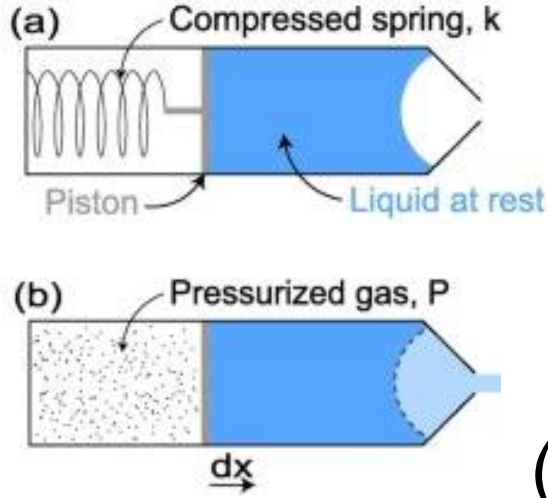
4 Transdermal Systems

SANDOZ A Novartis
Division



تقنيات لتحسين الإيتاء الجلدي

المحاقن بدون إبر Needle free Injection



1. فتحة المرذاذ nozzle orifice

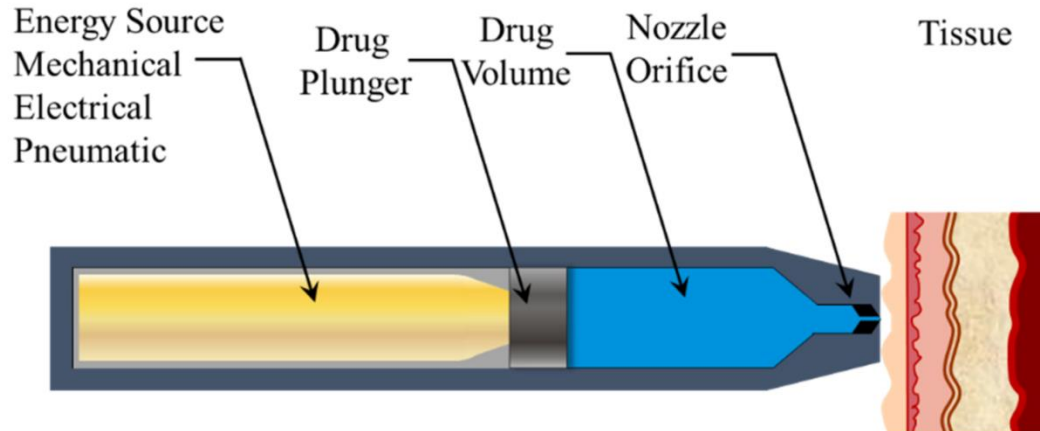
2. المكبس piston

3. حجرة الدواء

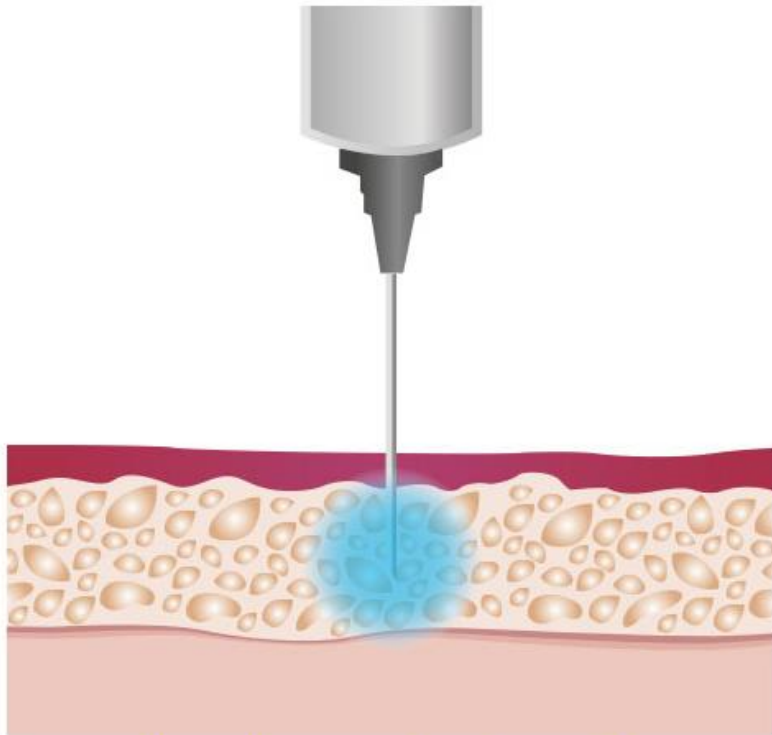
4. الدافعة plunger

5. مصدر الضغط

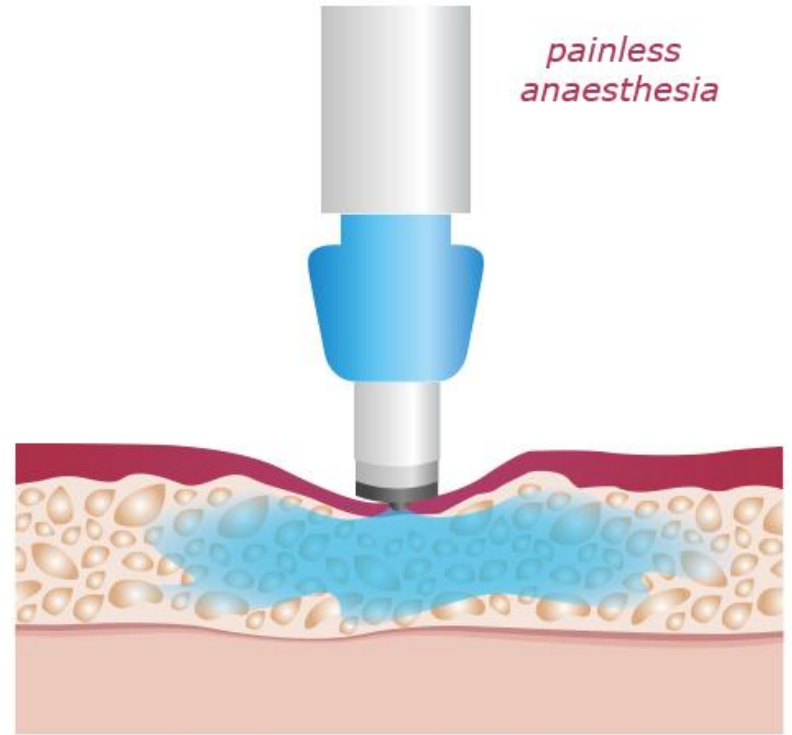
مخزن غاز (النتروجين أو CO₂) gas cartridge
أو نابض مضغوط compressed spring







*local anaesthesia with
needle injection*



*painless
anaesthesia*

*local anaesthesia with
needle-free injector*

الميزات:

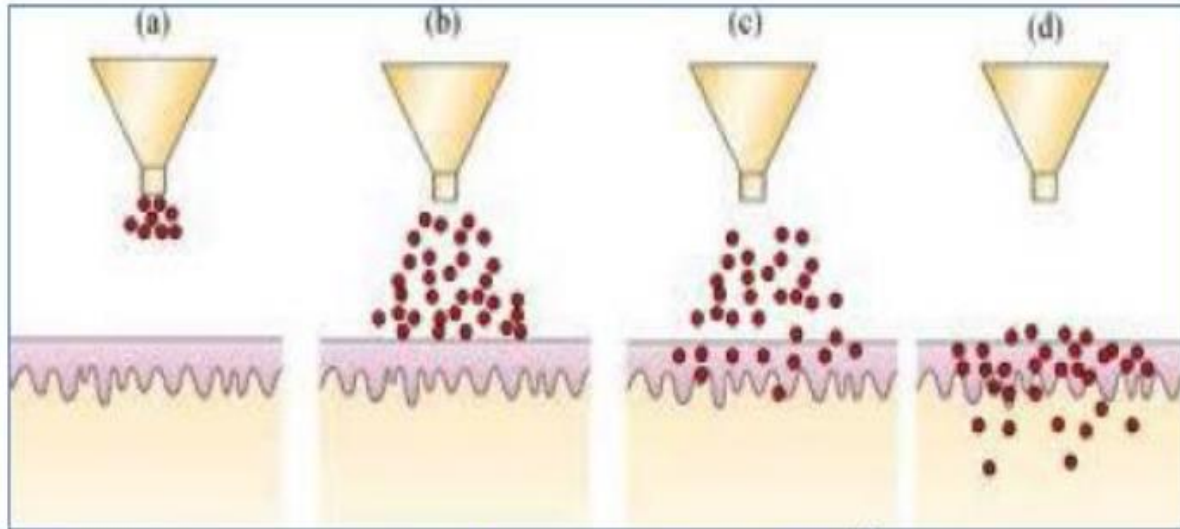
1. تمنع المخاطر المترافقة بثقب الجلد بما فيها النزف او اي ضرر آخر
2. طريقة ايتاء سريعة غير باضعة وبتكرارية أفضل من الطريقة التقليدية
3. ثباتية افضل اثناء التخزين كمسحوق جاف
4. تجنب مشاكل إعادة التشكيل المترافقة مع الأشكال المجفدة
5. تحسين المطاوعة (تقليل الخوف)

السيئات:

1. الطريقة معقدة و غالية
2. يحتاج المريض إلى تدريب لمعرفة الاستخدام
3. غير متاحة للطريق الوريدي

1) محاقن المساحيق

- تتألف من حجرة تحتوي على الدواء الصلب ومن فتحة لإطلاق الدواء باتجاه الجلد باستخدام مصدر للطاقة الذي يكون غاز مضغوط غالباً.
- تصطدم الجسيمات بسطح الجلد مما يؤدي إلى تكوين تجويف في الجلد مع تقدم الحقن.
- تتوضع جزيئات الدواء في نمط كروي في نهاية التجويف وتخترق الطبقة المتقرنة وبعد تغلغلها في الجلد ، تصبح متوزعة بالكامل في طبقة البشرة



(2) محاقن السوائل

- المبدأ الأساسي لهذا الحقن هو عند توليد الضغط العالي الكافي، سيستطيع السائل عند التماس الوثيق مع الجلد إحداث ثقباً في الجلد ويتم إيصاله إلى الأنسجة.
- تستخدم هذه الأنظمة الغاز أو النابض

