

对使用乙基纤维素水分散体制备的易溶性药物盐酸普萘洛尔缓释多颗粒配方的评价

Kevin Hoxha, Raxit Mehta, Manish Ghimire, Ali Rajabi-Siahboomi

Colorcon, Inc. 275 Ruth Road, Harleysville, PA, USA
www.colorcon.com

CRS
海报重印 2021

目的

在本项研究中，使用全配方的乙基纤维素水分散体包衣系统苏丽丝® (Surelease®)和 Aquacoat® ECD(一种可以按需要加入不同增塑剂的类型和数量的乙基纤维素水分散体)对易溶性模型药物盐酸普萘洛尔的缓释多颗粒配方进行评价。

方法

首先，在Bosch Hüttlin Unilab流化床中，使用基于HPMC的欧巴代® (卡乐康，美国)作粘合剂，按照70:30的药物与粘合剂比例，将盐酸普萘洛尔层积于850–1000µm药用丸芯(苏丽芯®, PF011 卡乐康，美国)上。然后，在配备有Wurster组件的流化床包衣机(Glatt GPCG-2)中，使用苏丽丝(卡乐康，美国)或Aquacoat ECD-30(卡乐康，美国)对多颗粒进行膜控包衣。在包衣之前，按照聚合物干重24% w/w的用量，将水溶性增塑剂柠檬酸三乙酯(TEC, Vertellus, USA)添加到Aquacoat ECD中。乙基纤维素水分散体包衣至10% w/w理论增重。使用相同的欧巴代系统于膜控包衣上进行外层包衣，包衣增重为1%w/w。然后将每批包衣多颗粒分成三等份，其中两份分别在60°C的烘箱中愈合2小时和24小时。在1000mL的37°C去离子水中，使用USP装置II (桨法)，在289nm波长下对多颗粒的药物释放进行表征。使用 f_2 相似因子对生成的溶出结果进行比较¹。 f_2 值介于50和100之间表明两个溶出曲线相似。利用扫描电子显微镜 (SEM, Phenom XL, Thermo Fisher Scientific, USA) 检查控释膜形态。

表 1: 物料配制概览

配方阶段	组分	固含量 (%w/w)	增重 (%w/w)
药物层积	盐酸普萘洛尔欧巴代	15	7
膜控包衣	苏丽丝	15	10
	Aqua coat ECD-30 + 24% w/w TEC	15	10
外层包衣	欧巴代	10	1

表 2: 苏丽芯包衣参数

工艺参数	药物层积	乙基纤维素包衣
设备	Hüttlin 流化床	Glatt GPCG-2
批次大小 (kg)	4 - 6 kg	2.0
进气温度 (°C)	57 - 58	53 - 65
产品温度 (°C)	45 - 50	41 - 46
排气温度 (°C)	41 - 46	38 - 44
雾化气压 (bar)	1.5	2.0
风量 (CMH)/(m³/h)	325	120 - 130
喷嘴尺寸 (mm)	1.2	1.2
供液速度(g/min)	12 - 24	10 - 14

结果: 溶出度

如图1图2所示, 苏丽丝包衣的多颗粒具有稳定的药物释放性能, 不受愈合时长的影响。

而Aquacoat ECD包衣的多颗粒则需要至少两个小时的愈合, 才能确保衣膜的完全愈合和一致的药物释放。

图1. 全配方乙基纤维素水分散体 (苏丽丝) 包衣的盐酸普萘洛尔缓释多颗粒的药物释放; 愈合时长的影响

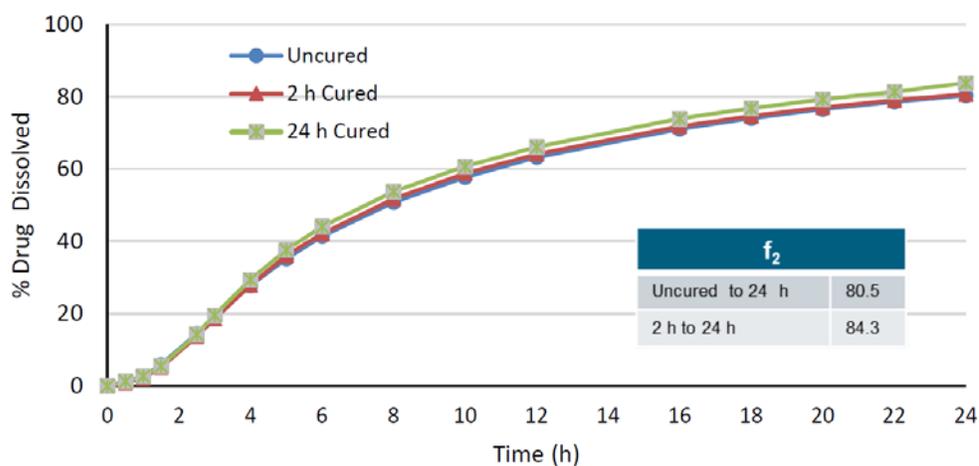
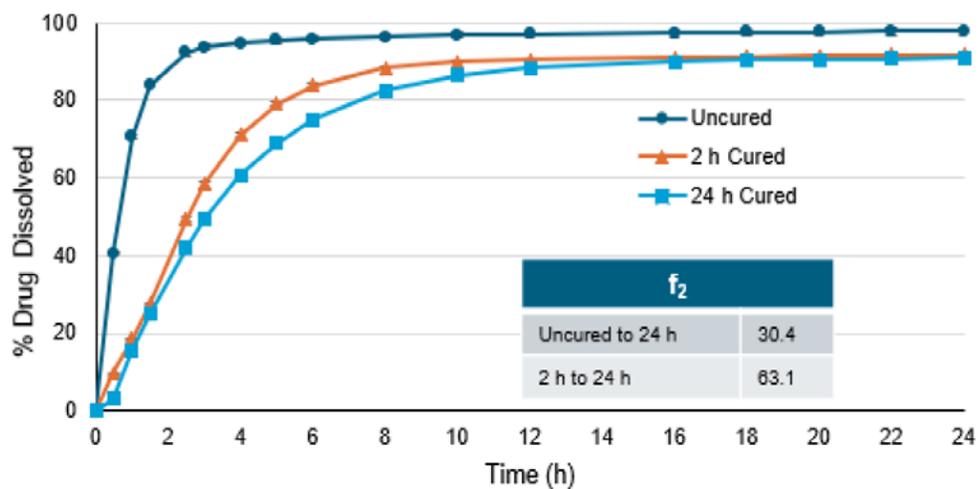
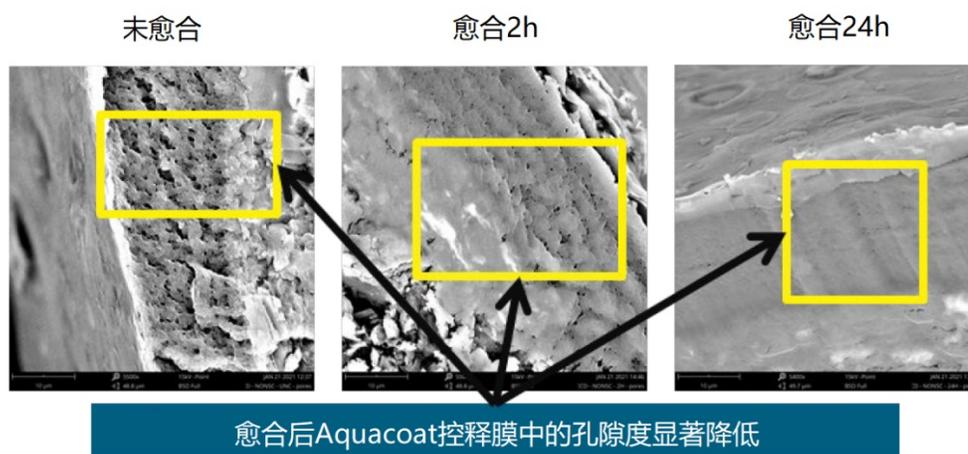
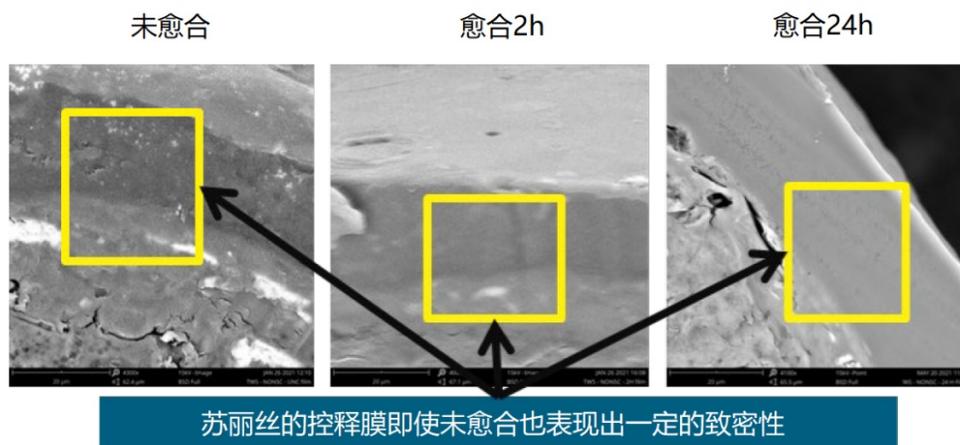


图2.乙基纤维素水分散体（Aquacoat）包衣的盐酸普萘洛尔缓释多颗粒的药物释放；愈合时长的影响



结果: SEM图像



结论

研究证实，使用乙基纤维素水分散体可以成功包衣得到盐酸普萘洛尔缓释多颗粒。乙基纤维素水分散体获得一致的药物释放。同时，结果显示了在开发缓控释多颗粒系统中愈合和工艺参数的重要性。

参考文献

1. Moore, J. W. and H. H. Flanner, 1996, "Mathematical Comparison of Dissolution Profiles,"
Pharmaceutical Technology, 20 (6) :64-74

根据我司所知及所信，本文包含的信息真实、准确，但由于方法、条件以及产品设备的差异，故不对产品任何推荐的数据或者建议提供明示或暗示性担保。在贵方的任何用途上，也不作同样的产品适用性担保。我司对意外的利润损失、特殊或相应的损失或损害不承担责任。

更多信息请与卡乐康中国联系，电话:+86-21-61982300/4001009611·传真:+86-21-54422229

www.colorcon.com.cn · marketing_cn@colorcon.com

北美
+1-215-699-7733

欧洲/中东/非洲
+44- (0) -1322-293000

拉丁美洲
+54-11-5556-7700

印度
+91-832-6727373

中国
+86-21-61982300

www.colorcon.com



© BPSI Holdings LLC, 2021.
本文所包含信息归卡乐康所有，未经许可不得使用。

* 除了特别指出外,所有商标均属BPSI公司所有

*Aquacoat® 是IFF公司注册商标。© 2021 IFF.版权所有

CRS_2021_Mehta_Surelease_CHN