

美多秀™ (METHOCEL™) K200M Premium 和 Premium CR 简介

IFF—卡乐康缓控释联盟已将用于缓释骨架配方的美多秀药用羟丙甲纤维素产品线扩展至 K200M Premium 和 K200M Premium CR, 这些新产品为制剂研究人员提供了额外的工具来满足他们对缓释骨架配方的需求。

美多秀 K100M 与美多秀 K200M 的性能对比

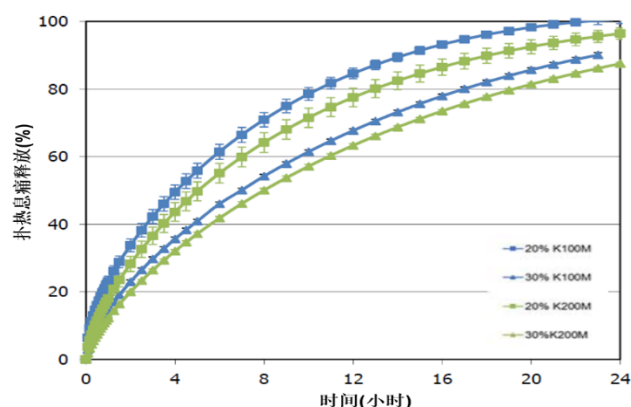
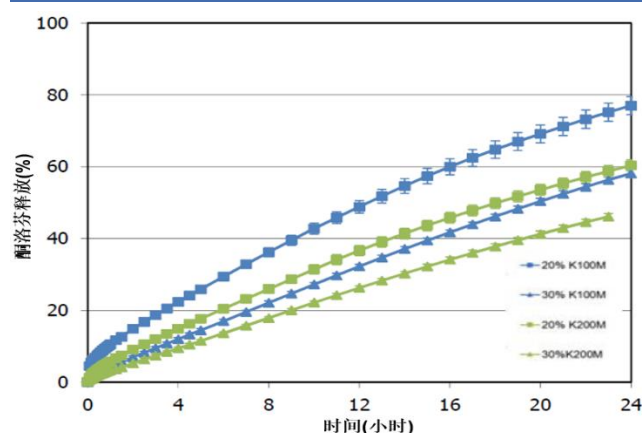
美多秀 K200M 与缓控释联盟提供的其他高粘度的美多秀羟丙甲纤维素聚合物一样, 具有相同关键物料属性的质量控制。

聚合物属性	K100M Premium	K100M Premium CR	K200M Premium	K200M Premium CR
粘度(cP)	75,000 - 140,000	75,000 - 140,000	150,000 - 280,000	150,000 - 280,000
羟丙基(HP)取代度(%)	7.0 - 12.0	9.5 - 11.5	7.0 - 12.0	9.5 - 11.5
甲氧基(MeO)取代度(%)	19.0 - 24.0	22.0 - 24.0	19.0 - 24.0	22.0 - 24.0
通过 100 目筛	Min 90%	Min 90%	Min 90%	Min 90%
通过 230 目筛	N/A	50 - 80%	N/A	50 - 80%

案例研究 1: 两种不同溶解度的模型药物的缓释结果

研究发现, 美多秀的用量和粘度显著影响药物释放。将两种不同溶解度的模型药物: 酮洛芬(BCS Class II, 0.05 mg/ml)和扑热息痛(BCS Class III, 14 mg/ml), 分别与美多秀制成 400mg 片重的缓释骨架片, 同时对溶出曲线进行检测。

药物释放受到羟丙甲纤维素的用量和分子量的影响

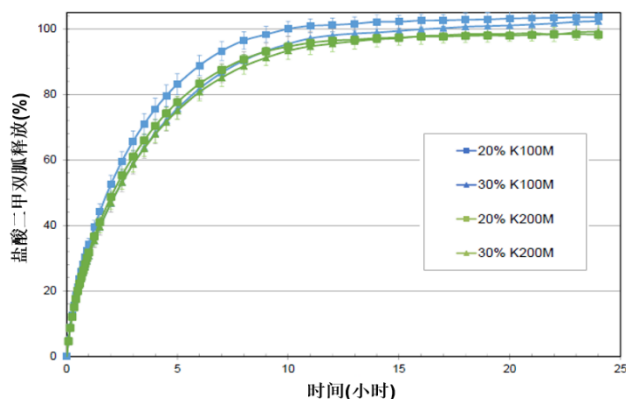


从美多秀 K100M 到 K200M, 相同用量下随分子量的增加药物释放变得更慢。

案例研究 2: 高剂量配方 - 盐酸二甲双胍

片重是高剂量活性成分, 如盐酸二甲双胍(BCS Class III, 水中溶解度>300mg/ml)主要的配方难题, 由于剂量高, 配方中留给辅料的空间有限。在不同聚合物用量下, 使用美多秀 K100M 或 K200M 制备四个片重为 1000mg 的盐酸二甲双胍配方。

美多秀粘度的影响取决于药物



- 使用30% w/w美多秀K100M和K200M的两种盐酸二甲双胍配方获得相同的释放曲线
- 降低美多秀 K200M 至 20% w/w 与 30% w/w 的配方有相似的盐酸二甲双胍释放结果, 因此可以帮助人员降低总体片重和片剂尺寸

- 作为亲水骨架片的最佳经验, 30%w/w的聚合物(高于临界渗透阈值)用来降低配方对CMA的潜在敏感性¹
- 较低的聚合物用量可能导致片与片之间和批与批之间的变异性增加

IFF—卡乐康缓控释联盟——无与伦比的强强联手

- 为制剂研究人员提供从美多秀 K100LV Premium CR 到 K200M Premium CR 的全系列高粘度羟丙甲纤维素
- 庞大的全球客户服务网络和本地供应分销机构
- 结合 IFF 世界级的聚合物和材料科学专业知识, 加上卡乐康丰富的配方经验和技术支持, 为客户提供无与伦比的服务

配方研发的其他考虑

- 初始配方库™(HyperStart®)口服固体制剂的初始配方服务, 为您出谋划策, 加快产品开发
- 结合使用善达™(Starch 1500®)部分预胶化玉米淀粉和美多秀能够进一步减缓缓释骨架片的药物释放²
- 应用速释包衣, 如欧巴代®(Opadry®)全配方薄膜包衣系统, 能够提高片剂的机械稳定性、改善吞咽能力, 同时通过包衣颜色帮助减少用药错误³⁻⁵

参考文献

1. H. Deng, S. Vass, S. Tiwari, T. Farrell, A. Faham, T. Cabelka & A. Rajabi-Siahboomi, "Application of Quality by Design (QbD) Principles to the Formulation of Extended Release Propranolol Hydrochloride Hydrophilic Matrix Tablets," American Association of Pharmaceutical Scientists (AAPS), San Francisco, CA, 2010.
2. M. Levina and A. Rajabi-Siahboomi, "Influence of Excipients on Drug Release from Hydroxypropyl Methylcellulose Matrices," *J. Pharm. Sci.*, Vol. 93, No. 11, Nov 2004: 2746-2754.
3. C. Wilson, B. O'Mahony, T. Farrell, B. Friend & D. Taylor, "Modern Tablet Film Coatings and Influence on Ease of Swallowing," AAPS, Salt Lake City, UT, 2003.
4. U.S. Department of Health and Human Services Food and Drug Administration Center for Drug Evaluation and Research (CDER), "Safety Considerations for Product Design to Minimize Medication Errors," Draft Guidance for Industry, December 2012.
5. U.S. Department of Health and Human Services Food and Drug Administration Center for Drug Evaluation and Research (CDER), "Size, Shape, and Other Physical Attributes of Generic Tablets and Capsules," Guidance for Industry, June 2015.

* Data shown generated by Dow Pharmaceutical and Food Solutions, Midland, MI, USA (2013-14).

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。

卡乐康公司不作任何明示或暗示性担保。即不担保客户在应用卡乐康产品的过程中不会侵犯任何第三方或实体持有的任何商标、商品名称、版权、专利或其他权利。

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

This document is valid at the time of distribution. Distributed 20-?-2022 (UTC)



© 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

*美多秀™/METHOCEL™是 IFF 公司注册商标。

TB_K200M_V1_0715_CHN