

使用最大料液输送速率测量评估防潮薄膜包衣的生产效率

目的

水性防潮薄膜包衣系统通常应用于片剂配方，以防止或减少片剂吸收环境湿气¹，从而增强片芯配方内的药物稳定性。本研究的目的是开发一种预测防潮薄膜包衣的薄膜包衣生产效率的小规模方法。采用了最大料液输送速率来评估配方的生产效率和固有粘着力。

方法

最大料液输送速率 (MFDR)

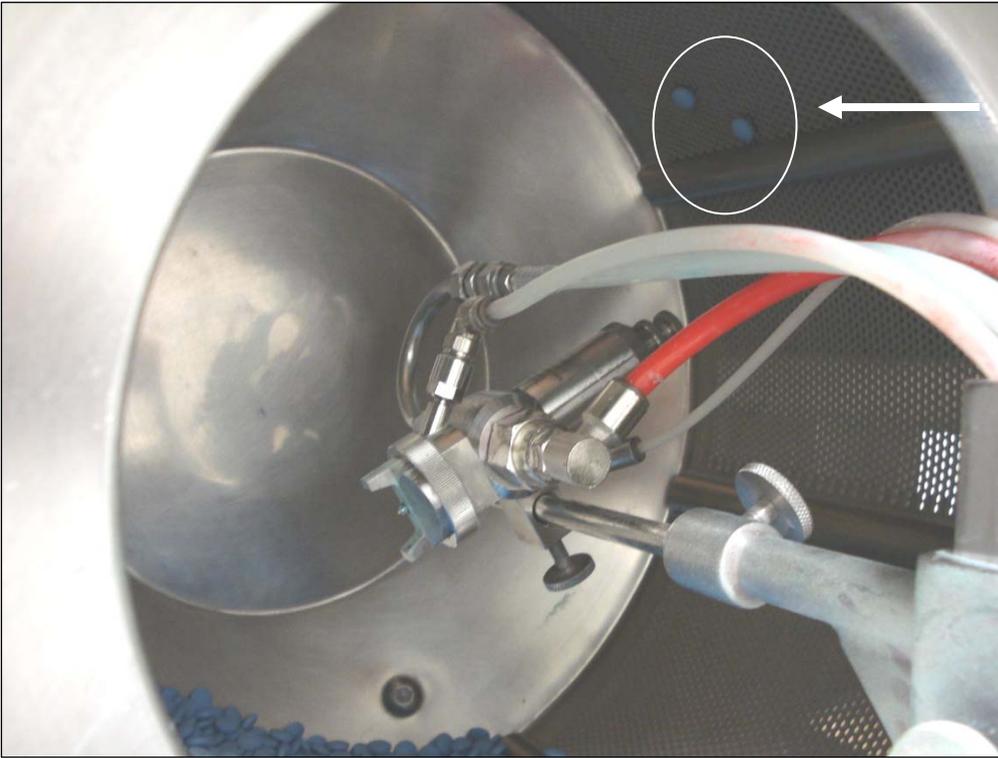
最大料液输送速率 (MFDR) 定义为在典型包衣工艺条件中不会导致片剂粘着在包衣锅上或结块的每分钟可喷涂到片床上的最多包衣悬液克数 (克/分钟)。本研究中的最大料液输送速率使用 1.5 kg 装量的标准凸面空白片剂 (直径为 10 mm) 测定，片剂在带有一个 15" 包衣锅隔板和 一个喷枪 (Schlick, 型号 931, 配有 1.2 mm 喷嘴) 的 O'Hara LabCoat II 全开孔、侧通风包衣锅中喷涂包衣。所使用的包衣工艺参数在表 1 中显示。

表 1. 包衣工艺参数

工艺参数	
进气温度 (°C)	65
片床温度 (°C)	45
气流 (m ³ /hr)	250
雾化气压 (bar)	1.5
锅速 (rpm)	22
喷枪与片床的间距 (cm)	10
雾型气压 (bar)	1.5

料液输送速率逐渐增加至在完成整翻过程中个别片剂粘着在包衣锅内侧时 (图 1)。此时降低喷液速率，以获得片剂不粘着在包衣锅内侧的速率。然后记录该喷液速率为最大料液输送速率。

图 1.包衣锅翻转过程中片剂粘着在包衣锅内侧图



水汽透过率 (MVTR)

水汽透过率测量水汽透过基片（在此研究中为薄膜包衣配方）的速率。通过将包衣分散液喷涂到聚对苯二甲酸乙二醇酯（PET）基片上（卡乐康内部方法）制备厚度为 $100\ \mu\text{m} \pm 10\%$ 的游离薄膜，在带有 $6.39\ \text{cm}^2$ 试验台的 WPA-100 装置（VTI 公司，美国）中使用该薄膜进行水汽透过率试验。首先在 25°C 温度下用干燥的氮气吹扫气流以 $200\ \text{cm}^3/\text{分钟}$ 的流速干燥 45 分钟，将薄膜干燥至平衡干燥状态。然后向吹扫气体加入水汽，在供试薄膜的一侧形成 80% 的相对湿度。监测供试薄膜另一侧的含水量，并在一段时间内测定水分透过薄膜的平衡透过率。试验周期结束的时间是在测定的透过率在五分钟内偏差低于 $0.005\ \text{克/水/天}/100\ \text{英寸}^2$ 时，或者允许的试验总时间已耗尽（一般最高达 4 小时）时，以先到者为准。本研究中评估了三种 PVA 基薄膜包衣分散系：欧巴代® amb 水性防潮薄膜包衣系统、欧巴代® II 型高性能薄膜包衣系统（PVA 基）及一种开发中的薄膜包衣系统。在 20% 的固体水溶液中制备这些配方并按表 1 中所列的条件喷涂到空白片芯中。然后测定每种薄膜包衣系统的最大料液输送速率和水汽透过率情况。

结果

图 2. 欧巴代 II (PVA 基) 游离薄膜的水汽透过率曲线

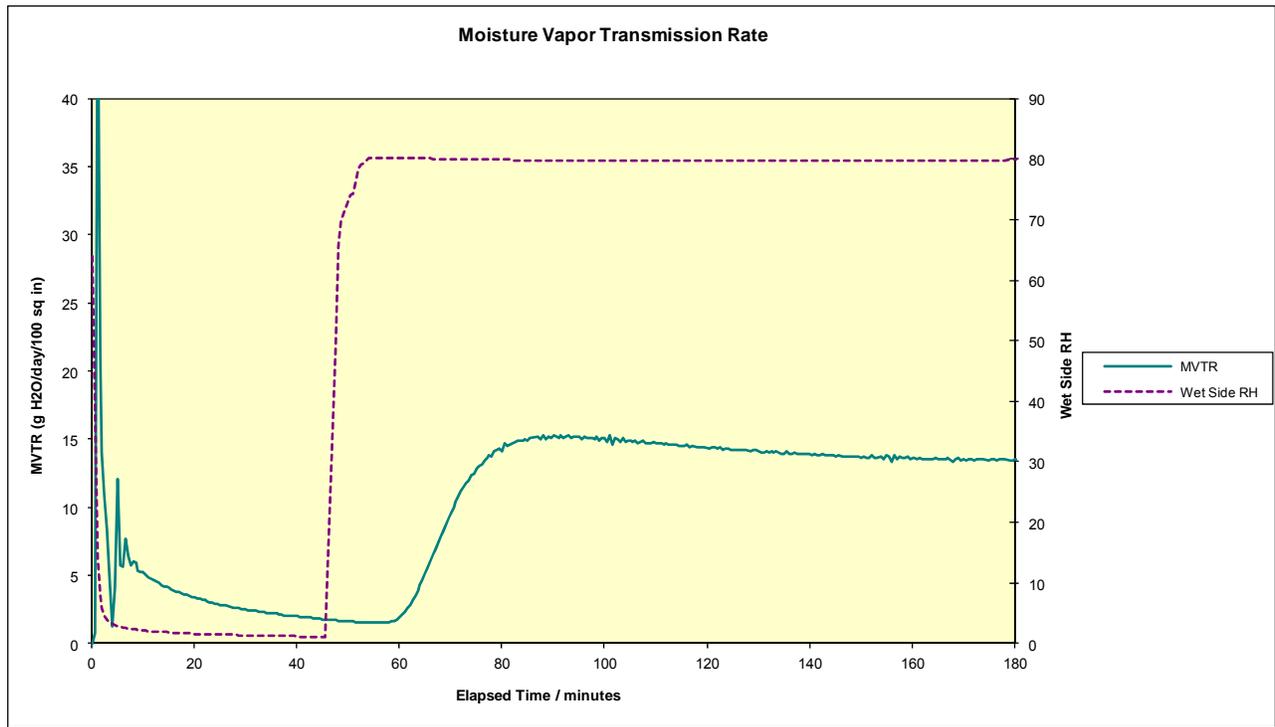


图 3. 欧巴代 amb 游离薄膜的水汽透过率曲线

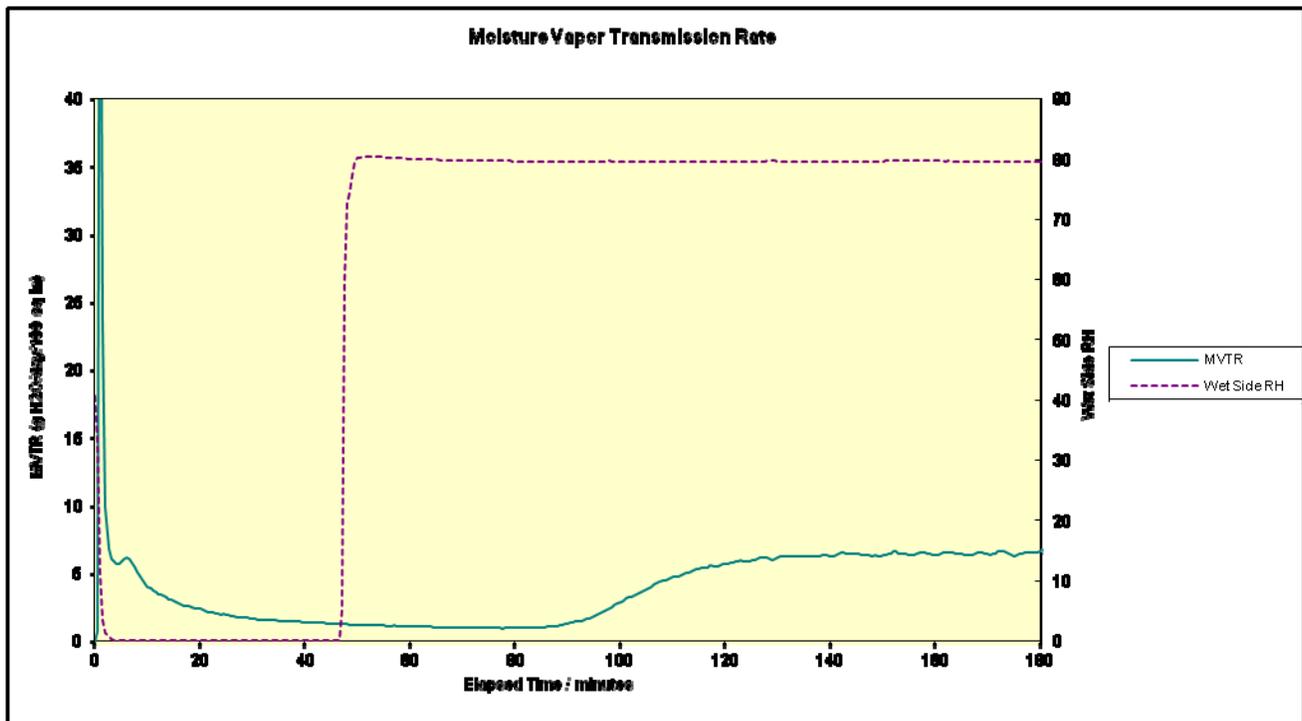


图 4. 开发中配方游离薄膜的水汽透过率曲线

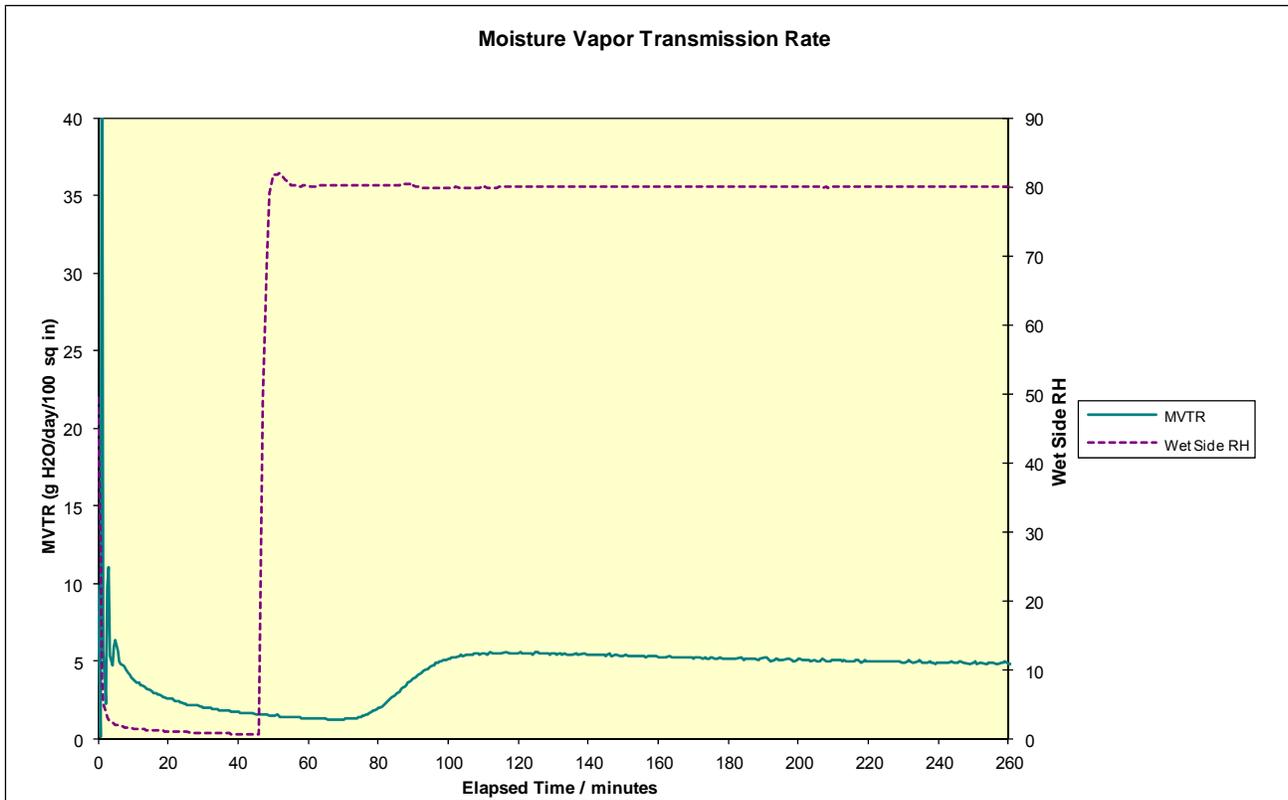


表 2. 包衣配方的最大料液输送速率和水汽透过率值

配方	最大料液输送速率 克/分钟	水汽透过率 克/水/天/100 英寸 ²
欧巴代 II 型 (PVA 基)	34	13.5
欧巴代 amb	11	6.4
开发中的配方	22	4.8

表 2 显示了本试验所研究的三种配方的最大料液输送速率和水汽透过率。虽然欧巴代 II 型 (PVA 基) 系统具有出色的生产效率, 但防潮特性不如欧巴代 amb 或开发中的配方有效。另一方面, 开发中的配方显示出最低的水汽透过率值及优良的生产效率。

结论

最大料液输送速率是区分薄膜包衣配方在典型包衣条件下的生产效率的简单定量方法。将作为生产效率指标的最大料液输送速率值与薄膜包衣水汽透过率 (MVTR) 分析相结合, 可优化薄膜包衣配方 (开发中的配方), 以达到对水分敏感的片剂的生产要求和防潮性能要求。

在 2009 年美国药学科学家协会会议上展示的海报重印版。

作者: Jason Teckoe、Tom Farrell 和 Ali R. Rajabi-Siahboomi。

参考文献

1. O.Bley, J. Siepmann, R.Bodmeier, Importance of glassy-to-rubbery transitions in moisture-protective polymer coatings, Eur. J. Pharm. Biopharm. 2009; 73: 146-153.

本文档所包含的信息, 就卡乐康公司最大限度所知, 是真实和准确的。鉴于产品商业化生产所使用的方法、条件和设备不尽相同, 卡乐康公司对于其提供的与产品相关的建议或提议不作任何默示的或明示的担保, 也不担保产品适合于您披露的任何应用。卡乐康公司对于收益损失或者偶然的、特别的或必然的损失或损害不承担任何责任。

卡乐康公司对下述情况不作任何明示或默示的担保, 即: 客户在使用卡乐康提供的产品时不会侵犯任何第三方个人或实体持有的任何商标、商品名、版权、专利或其它权利。

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

亚太地区
+65-6438-0318

拉美地区
+54-1-5556-7700

您也可以访问我们的网站: www.colorcon.com



©BPSI Holdings LLC, 2014 版权所有

本文所含的信息归卡乐康所有, 未经授权不得使用或传播。

除了特别指出外, 所有商标均属 BPSI 公司所有。

ads_opll_amb_mfdr_mvtr_V1_02_2011_CH