

凹形刻痕片的肠溶包衣

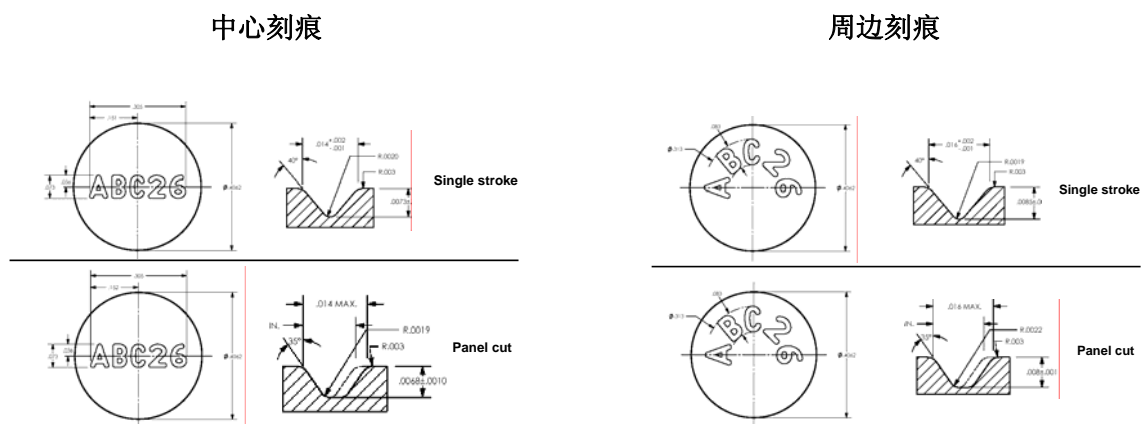
目的

以往对于肠溶包衣，考虑到肠溶薄膜的均匀性和完整性，通常都避免在片芯表面设计凹形刻痕。此项研究表明，通过精心设计片形，刻痕以及刻痕的位置可以得到很好的肠溶效果，从而可以避免采用印字的方法。

实验方法

材料

阿司匹林 (Rhodine 2371, Rhodia, Cranbury, NJ)，微晶纤维素(Emcocel® 90M, JRS Pharma, Patterson, NY)，硬脂酸(Purified vegetable grade powder, Oleotec Ltd., London, England)。采用直接压片法制备 Aspirin片，片重325mg，圆形（Φ0.4062”）“复合半径式”冲头 (Natoli, St. Charles, MO)具有不同的刻痕模式及位置。选择字符“ABC26”为刻痕。此刻痕分别设计在穿过片芯的中央或环绕片芯的周边。刻痕模式分别采用“single stroke cut”式(具有固定的宽度，锥度(40°)，以及深度，完整的单复合半径式)；“panel cut”式(刻痕底部为平面)。同时制备一些普通的无刻痕的样片。



采用打孔侧通风锅，直接进行肠溶包衣或先打底（欧巴代®Opadry®，增重 2%）再包肠溶衣，肠溶层增重均为 10%。包衣过程中，当理论增重至 6, 7, 8, 9 和 10 % (经过打底的样品在增重至 4 和 5%) 时分别取样，样品用来进行抗酸及刻痕清晰度测试。抗酸实验采用欧洲药典方法(European Pharmacopoeia 3rd Edition 2001 supplement). 即取 6 片肠溶衣样片分别称重后置于 0.1N HCL 中，2 小时后将保持完整的药片取出用毛巾擦干并再次称重，计算增重的百分数为酸摄取量。当酸摄取量小于 5%，则认为药片可以通过延迟释放制剂溶出试验中的抗酸测试。1

结果

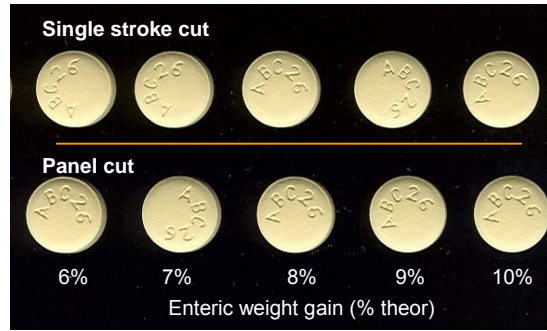
经目测观察，药片经包衣后（肠溶层增重10%），仍然保持清晰的刻痕。刻痕的清晰度与刻痕设计的模式及刻痕位置无关。

抗酸实验表明，经过肠溶包衣的样片，在增重低于10%时即可通过抗酸测试。采用不同刻痕模式和刻痕位置的样片，结果没有明显的差异。

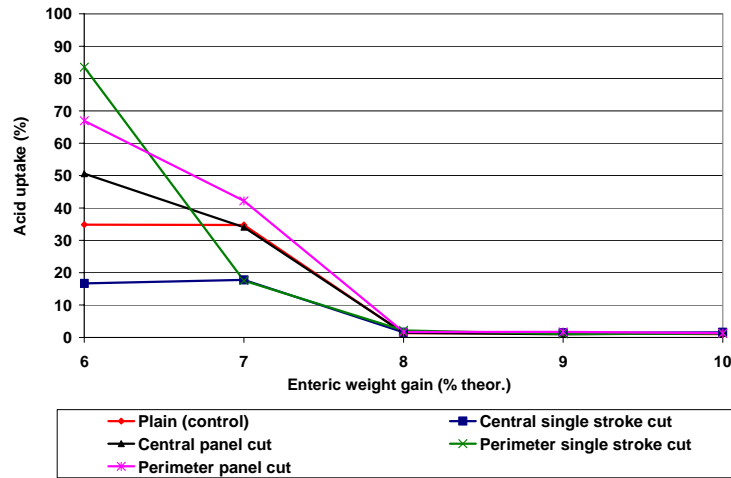
中心刻痕-无底层包衣



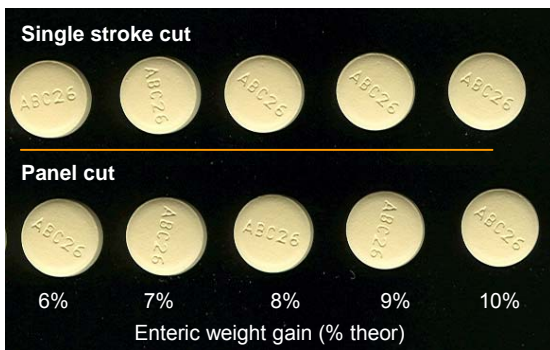
周边刻痕-无底层包衣



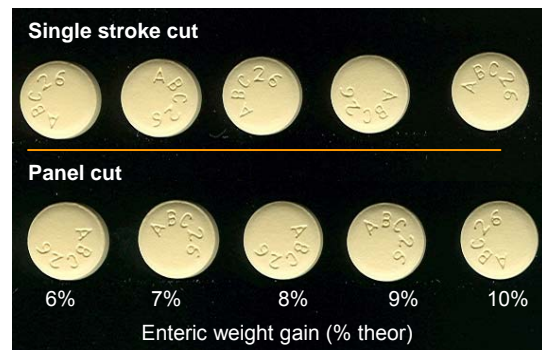
酸摄取值 - 无底层包衣



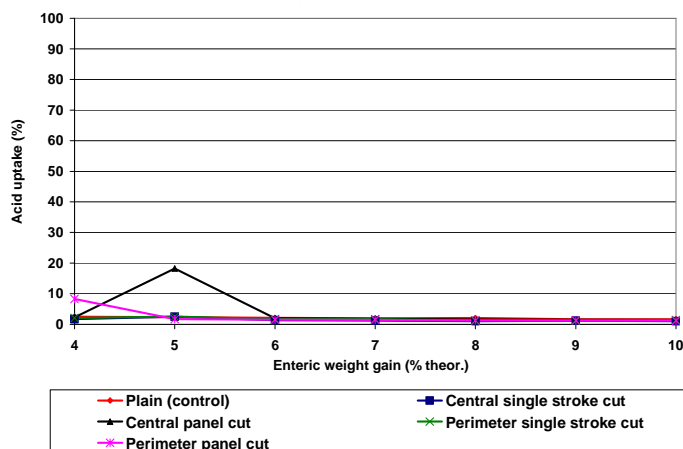
中心刻痕-有底层包衣



周边刻痕-有底层包衣



酸摄取值 - 有底层包衣



抗酸实验中，泄露点往往出现在片芯的边缘而不是刻痕处。正如事先预料，没有发现因为刻痕处缺损而导致抗酸测试失败的情况。此外，实验表明，通过打底，虽然刻痕的清晰度方面有细微的差别，但却可以显著降低肠溶包衣材料的用量，同时保持良好的抗酸效果。打底材料的应用可以有效地提高片芯外缘的强度，减少片芯边缘的缺损。

结论

采用典型的刻痕设计模式及刻痕位置对肠溶片的抗酸效果及刻痕清晰度不会产生显著影响。本实验采用的肠溶包衣材料具有良好的附着力，从而表现出很好的刻痕清晰度及抗酸效果。边缘磨损是影响抗酸效果的主要因素。

通过精心设计片形，刻痕以及选择适合的肠溶包衣系统来制备肠溶片，可以避免采用印字等其他提升品牌及识别系统的方法。

参考文献:

1. Jordan, M.P., Taylor, J., Hadfield, P.J.; "A Comparison of the Performance Characteristics of Enteric Film Coating Systems", Contributed paper, AAPS National Meeting, October (2001).

* Eudragit = registered trademark of Rohm GmbH & Co. KG

更多信息请与卡乐康中国联系, 电话:8009881798·+86-21-54422222·传真:+86-21-54422229

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

北美

+1-215-699-7733

欧洲/中东/非洲

+44-(0)-1322-293000

亚太区

+65-6438-0318

拉丁美洲

+54-11-4552-1565

www.colorcon.com



© BPSI Holdings LLC, 2010. 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 实公司所有

ads_acryleze_ent_coat_tab_CHN_03_2010