

A150和直压乳糖对片剂孔隙率和崩解时间的影响

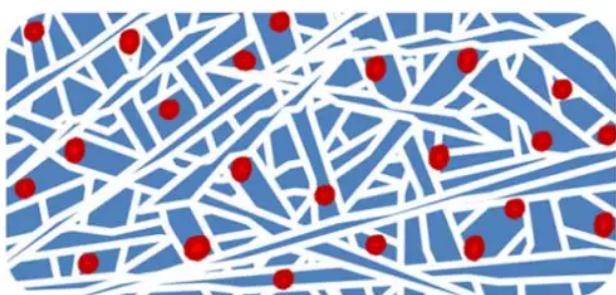
原创 优普惠 优普惠 2020-03-08



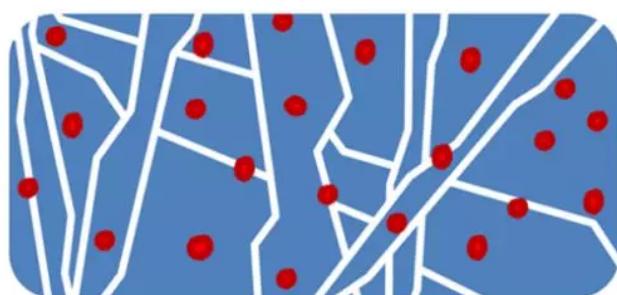
使用了无水磷酸氢钙A150的片剂显示更高的孔隙率，是直压乳糖的3-5倍，这有助于水分的渗透。使用了A150的片剂的崩解时间比用了直压乳糖的缩短3-5倍。与直压乳糖相比，使用A150可制备崩解时间更短的硬度更大的片剂。

01 快速崩解机制

常用的崩解剂（如交联羧甲基纤维素钠、聚乙烯吡咯烷酮、羧甲基淀粉钠等）都需要水，因为它们的作用机制依赖于快速吸水和大量溶胀。当少量液体接触制剂（润湿的）并通过毛细管作用渗透片剂基质时，崩解就开始了。所以想要成功开发速释制剂，必须把包括孔隙率在内的基质结构考虑进去。



高孔隙率基质——水分易于渗透并润湿和崩解颗粒



低孔隙率基质——水渗透有限，崩解颗粒不会膨胀

02 A150和乳糖的对比实验

1 实验材料

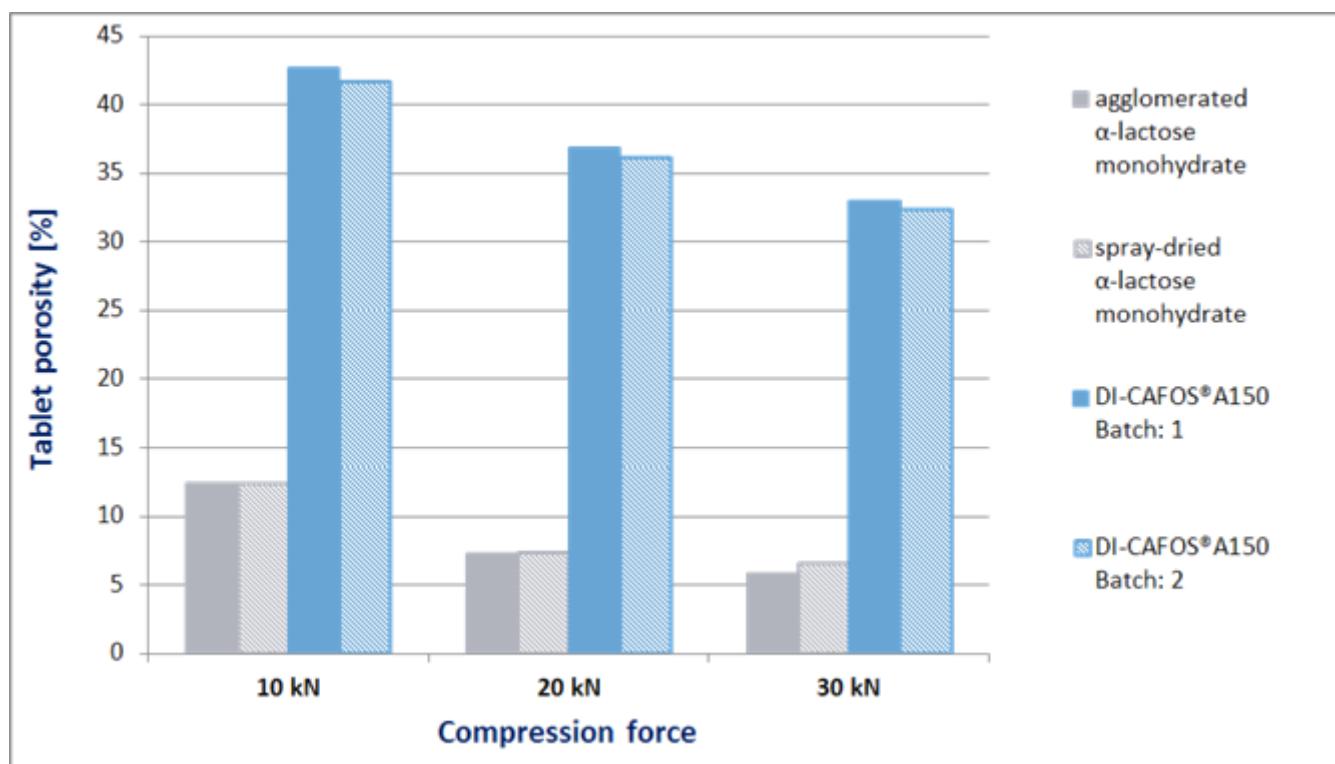
- 无水磷酸氢钙：DI-CAFOS[®] A150（两批）
- 乳糖I：直压型聚 α -乳糖一水合物（LMG）/agglomerated α -lactose monohydrate
- 乳糖II：直压乳糖，喷雾干燥制得的 α -乳糖一水合物（LMS）/spray-dried α -lactose monohydrate

2 片剂配方

- 直压型磷酸氢钙A150/直压乳糖 : 97.5%
- 交联羧甲基纤维素钠 : 2.0%
- 硬脂酸镁 : 0.5%
- 片重 : 250mg
- FETTE 102i 旋转压片机
- 压片速度 : 62.5转/分
- 冲孔 : 8m 平面
- 压实力 : 10kN、20kN、30kN

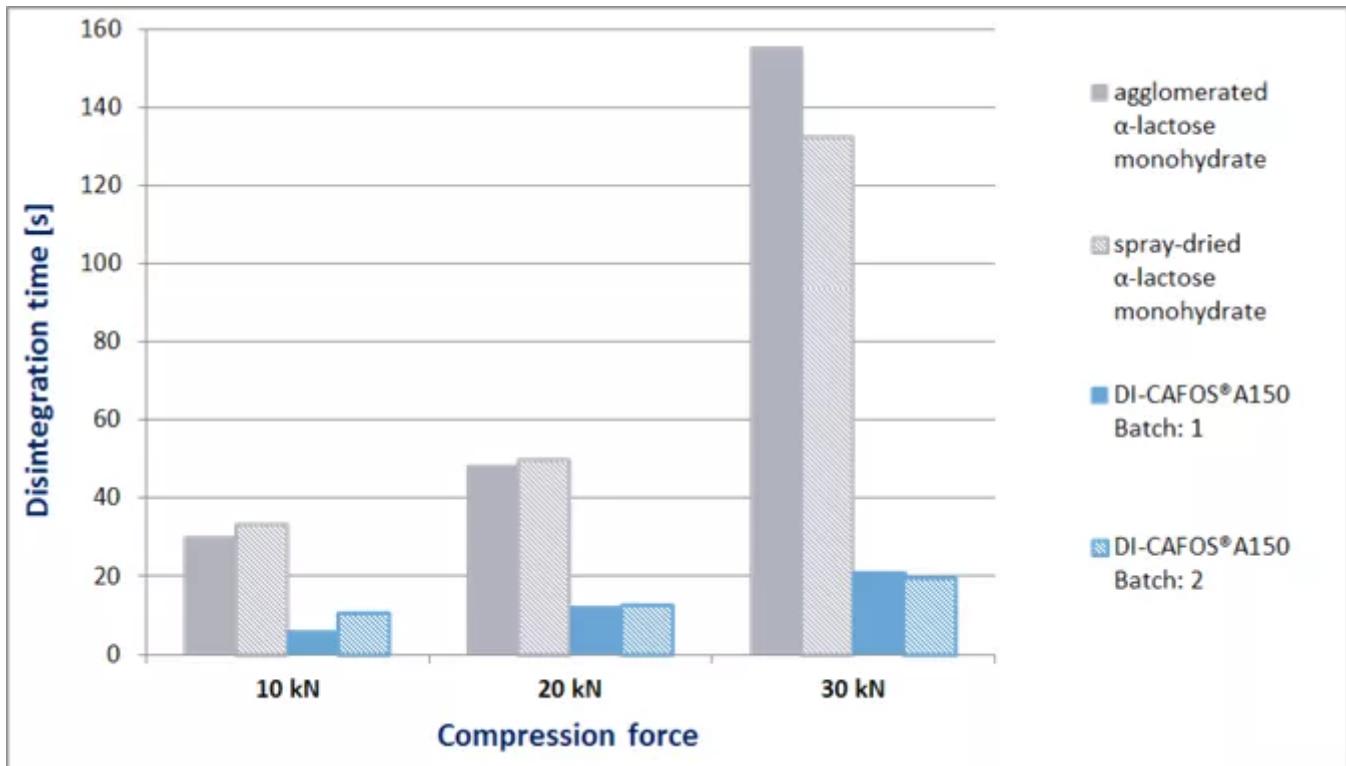
3 实验结果

① 片剂孔隙率



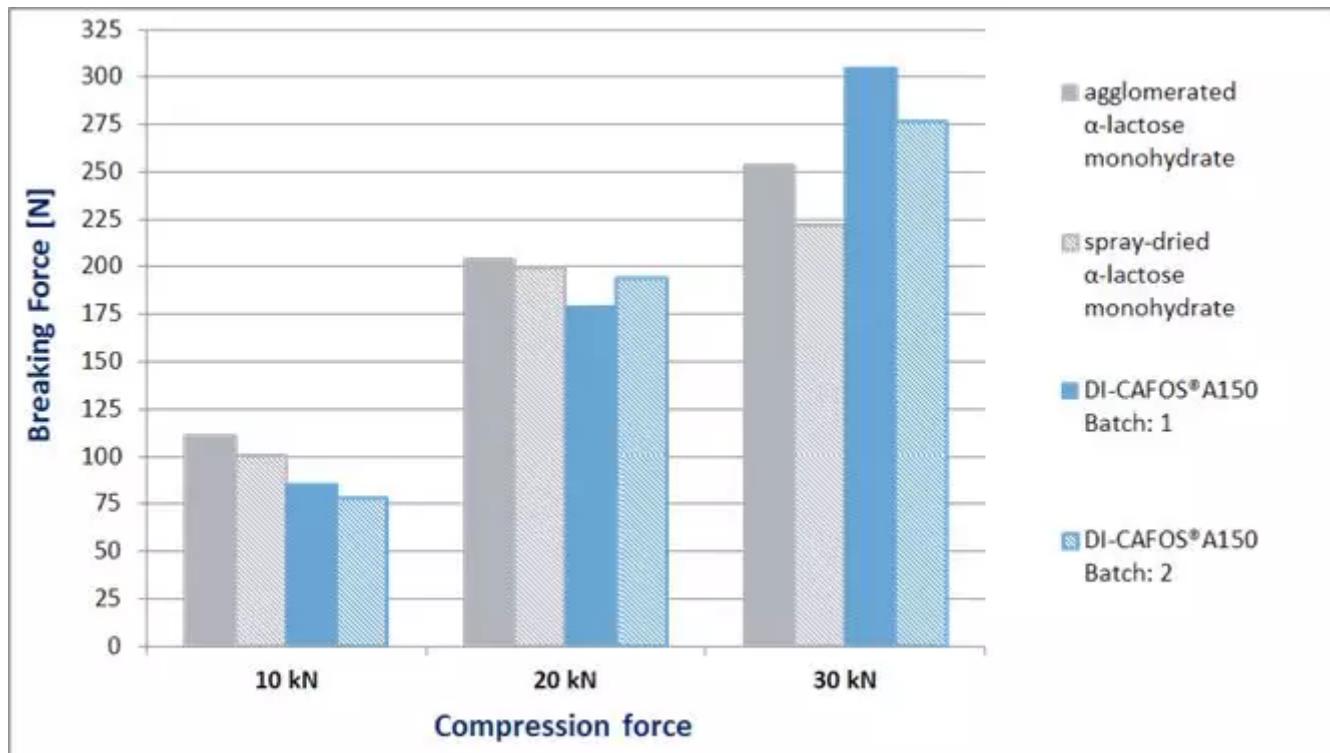
>>> 相同压实力下，使用磷酸氢钙A150，其孔隙率相比使用乳糖要高很多。

② 崩解时间



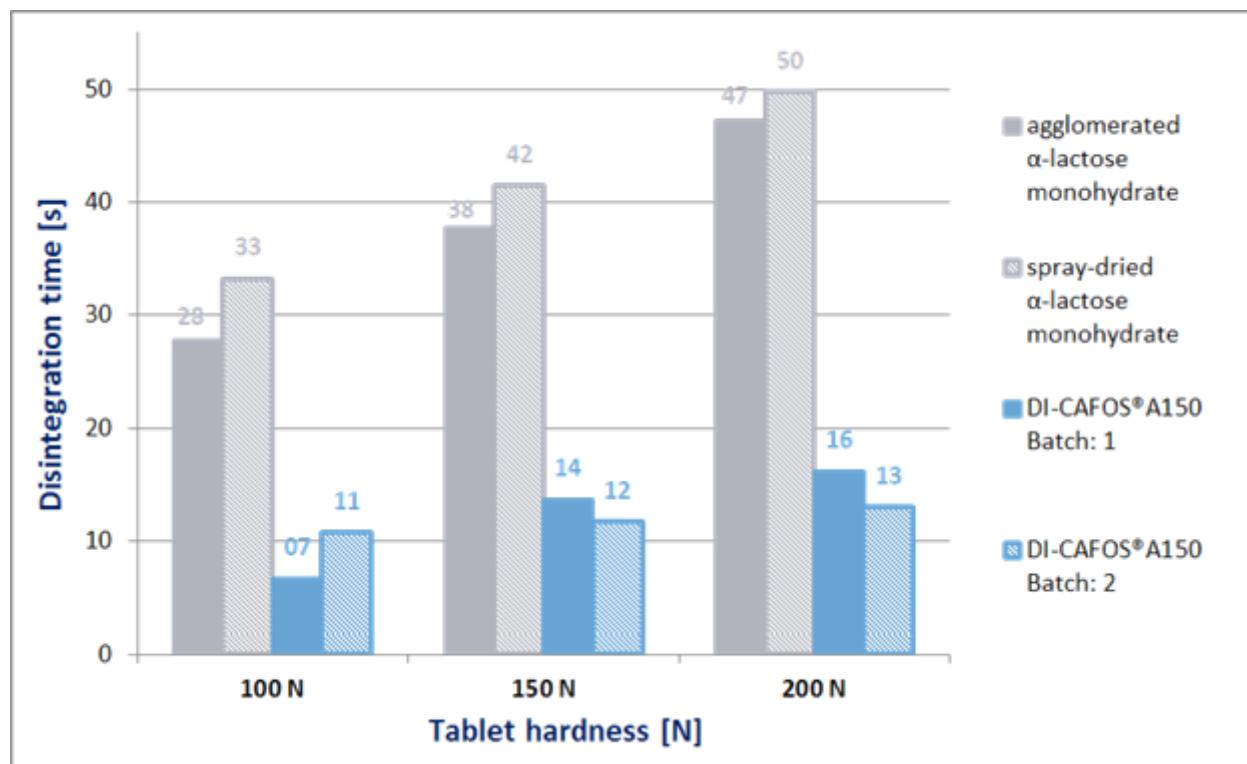
>>> 使用磷酸氢钙A150，崩解时间相对乳糖短很多

③ 片剂硬度（破碎力）



>>> 压实力越大，使用磷酸氢钙A150的片剂硬度越大。

④ 相同硬度（破碎力）片剂的崩解时间的比较



>>> 相同硬度片剂的崩解时间对比，仍是使用磷酸氢钙A150的片剂崩解时间更短。这说明在配方中使用磷酸氢钙A150加强片剂的硬度，不会造成崩解时间的延长。

4 实验结论

- 使用了DI-CAFOS® A150的片剂显示更高的孔隙率，是直压乳糖的3-5倍，这有助于水分对片剂基质的渗透。
- 使用了DI-CAFOS® A150的片剂的崩解时间比含有直压乳糖的片剂的崩解时间短3-5倍。
- 与直压乳糖相比，使用DI-CAFOS® A150可以制备崩解时间更短的硬度较大的片剂。

-
- ◆ 新品 | 羟丙甲纤维素植物胶囊推荐
 - ◆ 胶囊填充工序不良原因分析与对策
 - ◆ 无水磷酸氢钙CDE登记号已公布
 - ◆ 微晶纤维素-甘露醇（TMT934）共处理辅料功能性研究

喜欢本文点个在看



[阅读原文](#)

喜欢此内容的人还喜欢

[Budenheim磷酸盐的微观之美](#)

优普惠