

EUDRAGIT® FS 30 D

药用聚合物的特点及在药物制剂中的应用

Rohm pharma polymers



EVONIK
INDUSTRIES

相 关 内 容

1.EUDRAGIT® FS 30 D 产品特性

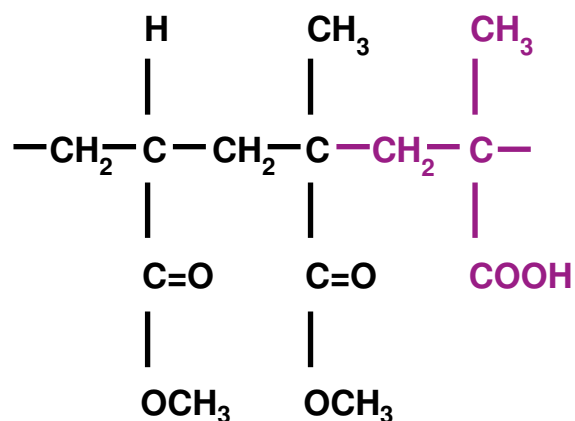
2.结肠靶向

- 片剂包衣
- 多颗粒包衣
- 包衣颗粒的压片

3.pH 非依赖型骨架片

4.与其它聚合物合用，形成特殊靶向

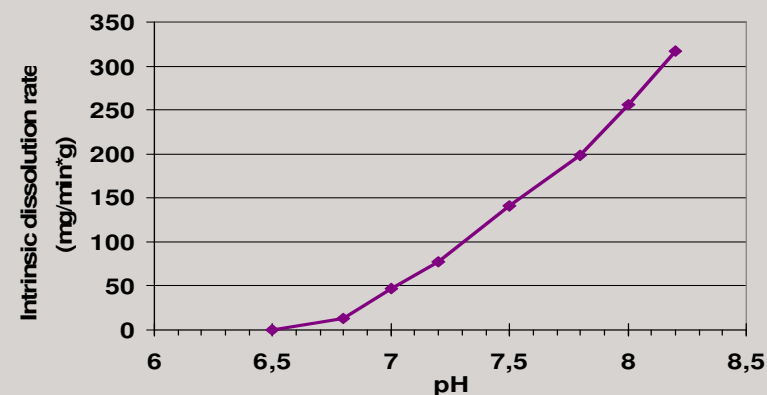
EUDRAGIT® FS 30 D 产品特性



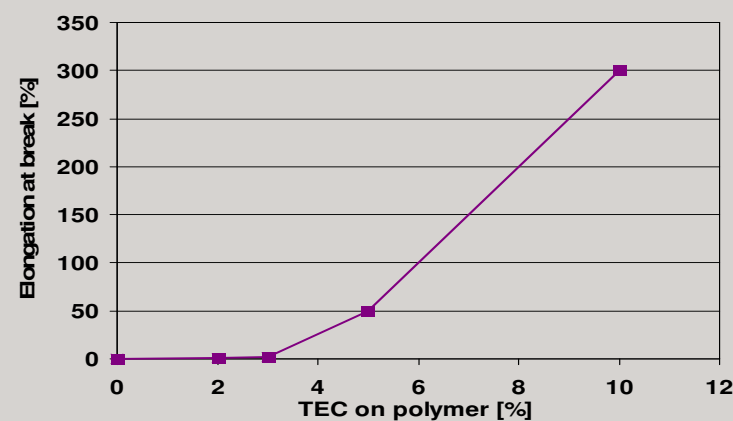
Methyl acrylate / methyl methacrylate / methacrylic acid

理化特性

溶解性	> pH 7.0
玻璃化温度 (T _g)	~ 48 °C
最低成膜温度 (MFT)	~ 14 °C
平均分子量	~ 220,000



EUDRAGIT® FS 30D 游离膜的溶解速度



增塑剂TEC对延展性的影响

EUDRAGIT® FS 30 D (滑石粉)

片剂包衣配方



		固体量	干聚合物计
EUDRAGIT® FS 30 D	5,953 g	1,786 g	
Talc	893 g	893 g	50%
TEC	89 g	89 g	5%
Water	6,905 g	---	
Total	13,840 g		

总固含量: 20.0%

聚合物含量: 12.9%

聚合物用量: 5.0 mg/cm²

总增重: 7.8 mg/cm²

EUDRAGIT®FS 30 D (GMS)

片剂包衣配方



		固体量	干聚合物计
EUDRAGIT® FS 30 D	5,953 g	1,786 g	
GMS	89 g	89 g	5%
Polysorbat 80 (33% aqu.)	108 g	36 g	40% on GMS
TEC	89 g	89 g	5%
Water	3,761 g	---	
Total	10,000 g		

总固含量: 20.0%
 聚合物含量: 17.8%
 聚合物用量: 5.0 mg/cm²
 总增重: 5.6 mg/cm² —► 仅为滑石粉处方的~ 70%用量

EUDRAGIT® FS 30 D 用于 小丸/颗粒包衣的配方（GMS）



		固体量	干聚合物计
EUDRAGIT® FS 30 D	500.0 g	150.0 g	
GMS	7.5 g	7.5 g	5%
Polysorbate 80	3.0 g	3.0 g	40% on GMS
TEC	7.5 g	7.5 g	5%
Water	154.0 g	---	
Total	672.0 g		

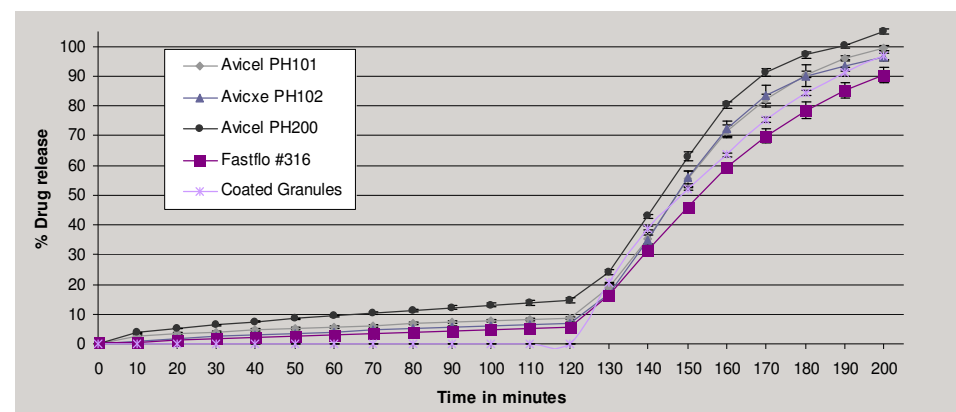
固含量: 25.0%

聚合物含量: 22.3%

EUDRAGIT®FS30D包衣颗粒的 压片技术



	Amount	%
Coated Theophylline Granules	526.4 g	65.85%
Avicel PH 200	221.6 g	27.7%
NaCMC	40.0 g	5.0%
Mg stearate	12.0 g	1.5%
Total	800.0 g	



包衣茶碱颗粒用于压片（10 kN）硬度，不同填充剂

- EUDRAGIT® FS 30 D 薄膜的延展性能保证包衣颗粒的可压性。
- MCC 的不同级别可能影响片剂的硬度和压片后药物的溶出表现。

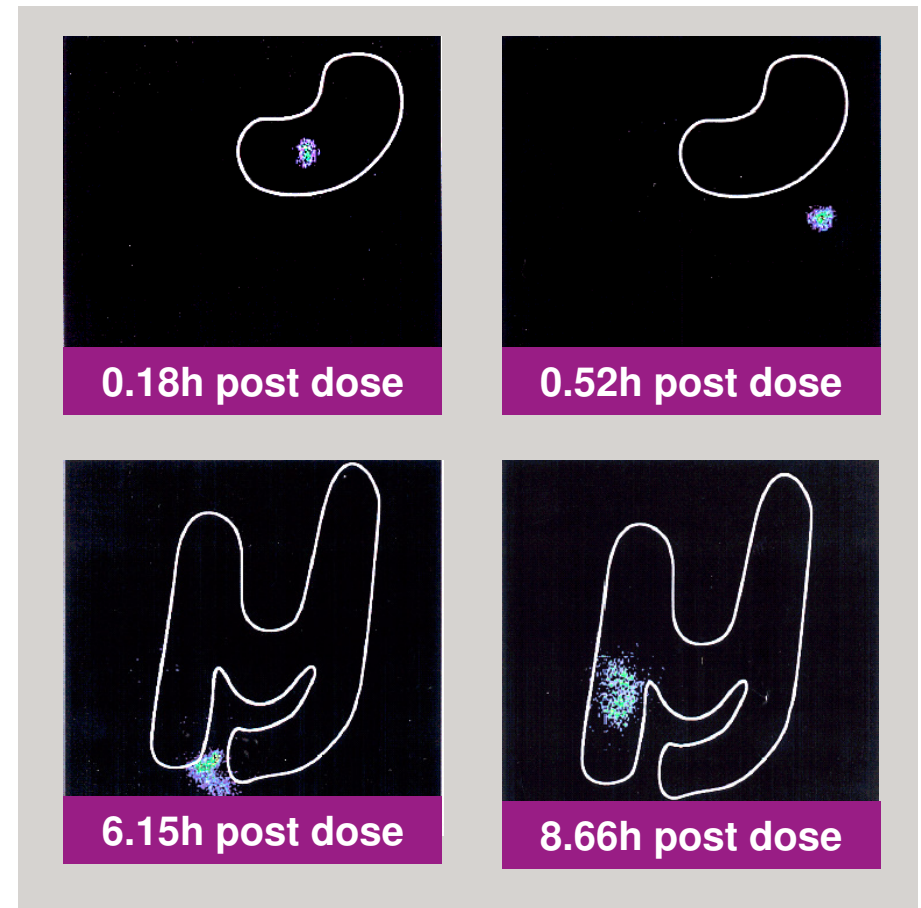
应用Gamma照像技术对体内外相关性评价



EUDRAGIT® FS 30 D包衣的HPMC胶囊在体内转运和崩解的过程

Subject	Gastric Emptying	Colon Arrival	Initial Time	Compl. Time
Mean	1.5hrs	3.5hrs	4.2hrs	6.9hrs
SD	1.1	0.8	2.0	2.1

- 8位志愿者，随机分组
- EUDRAGIT® FS 30 D包衣胶囊在小肠末梢，近大肠处崩解



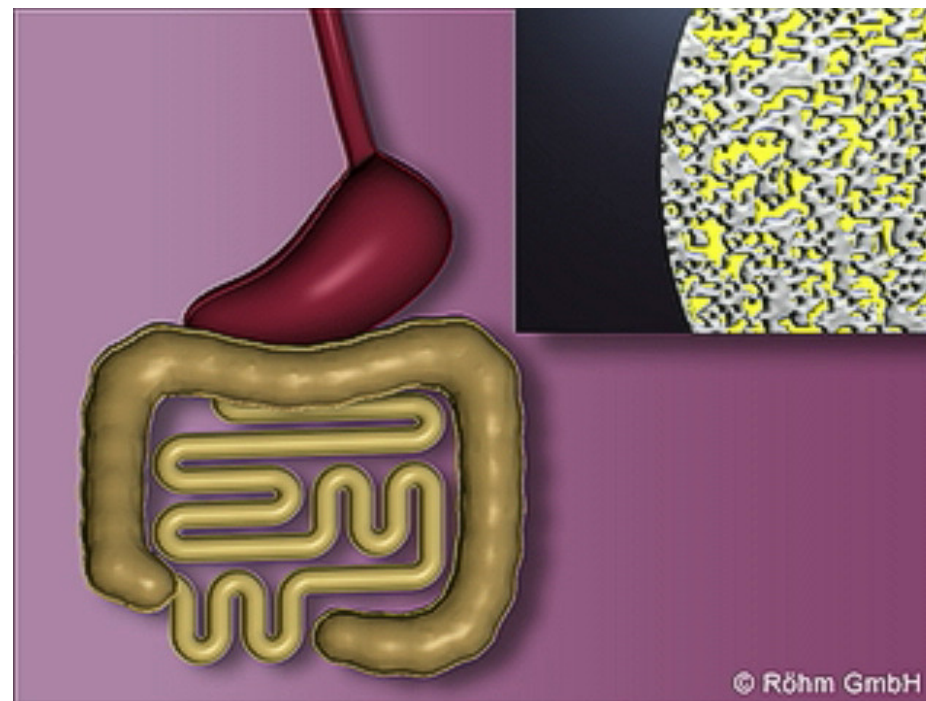
E. Cole et al., Proceedings of the AAPS Annual Meeting 2001 in Denver, USA

EUDRAGIT® FS 30D 在pH 非依赖型骨架片中的应用



pH非依赖型骨架片的工作原理

- **EUDRAGIT® FS 30 D** 的pH非依赖型骨架主要通过扩散过程进行释药
- 优点在：药物可**100%**在结肠部位释放



EUDRAGIT® FS 30D 制备pH非依赖型骨架片



	主要成分	批 量	每 片	%
湿法制粒	Diltiazem	1,450.0 g	145.5 mg	29.0 %
	Emcompress®	2,695.0 g	269.5 mg	53.9 %
	EUDRAGIT® FS 30 D	*830.0 g	*83.0 mg	16.6 %
压面性片	Mg stearate	25.0 g	2.5 mg	0.5 %
总 计		5,000.0 g	500.0 mg	100.0%

* 干聚合物用量

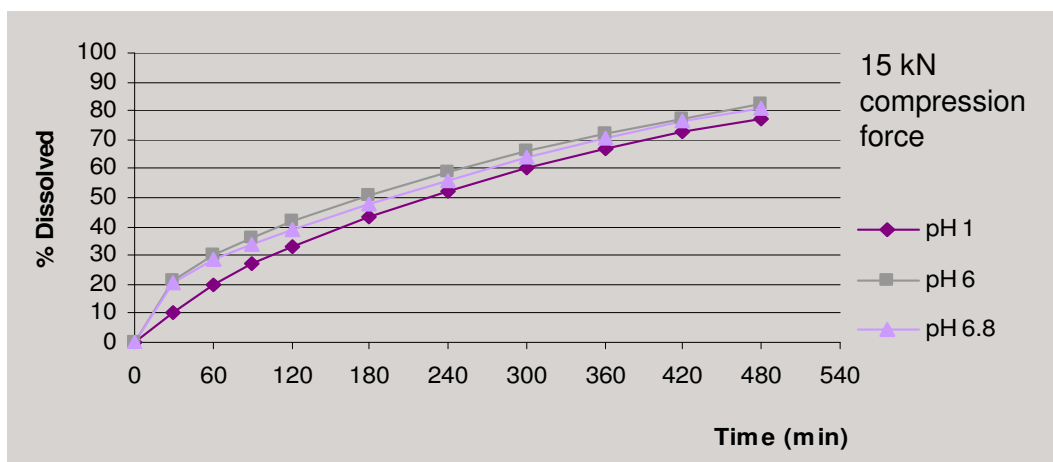
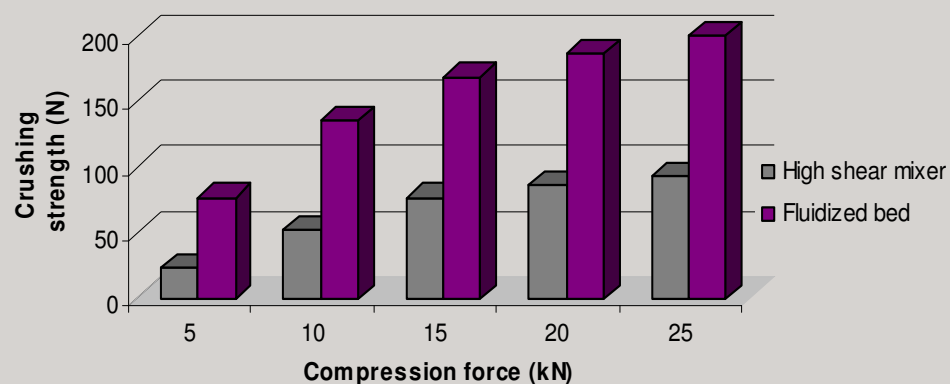
➡ 10 to 20% 聚合物用量即可有效地控制药物释放

湿法制粒过程的选择及其对可压性的影响



- 流化床制备的颗粒，较软，压片硬度高，重现性好

35% Diltiazem, 500mg tablet weight, EUDRAGIT® FS 30 D



- 15kN 硬度的片剂，在不同PH介质中有相似的表现

EUDRAGIT® FS 30 D & L 30 D-55

聚合物的组合使用



EUDRAGIT® FS / L ratio	50:50	75:25	80:20	85:15	90:10
EUDRAGIT® FS 30 D	1000 g	1500 g	1600 g	1700 g	1800 g
EUDRAGIT® L 30 D-55	1000 g	500 g	400 g	300 g	200 g
Talc	300 g				
TEC	37.5 g				
Water dem.	2350 g				

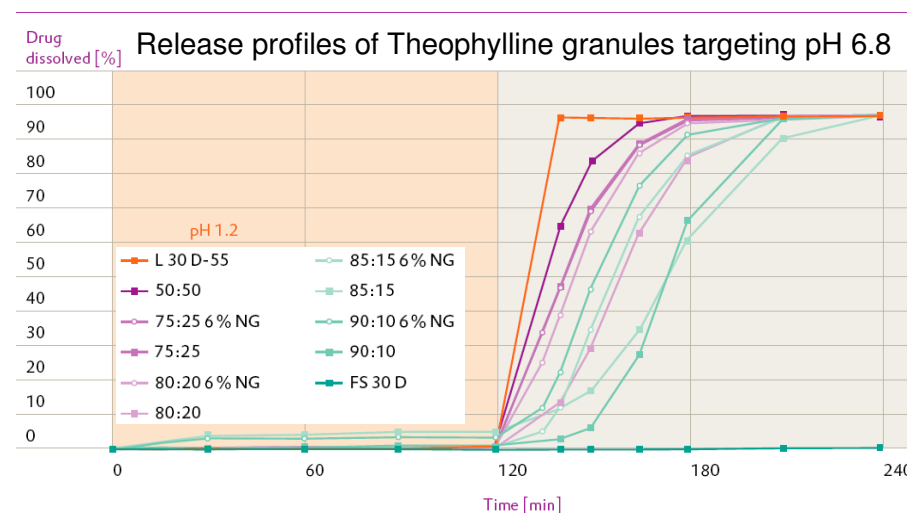
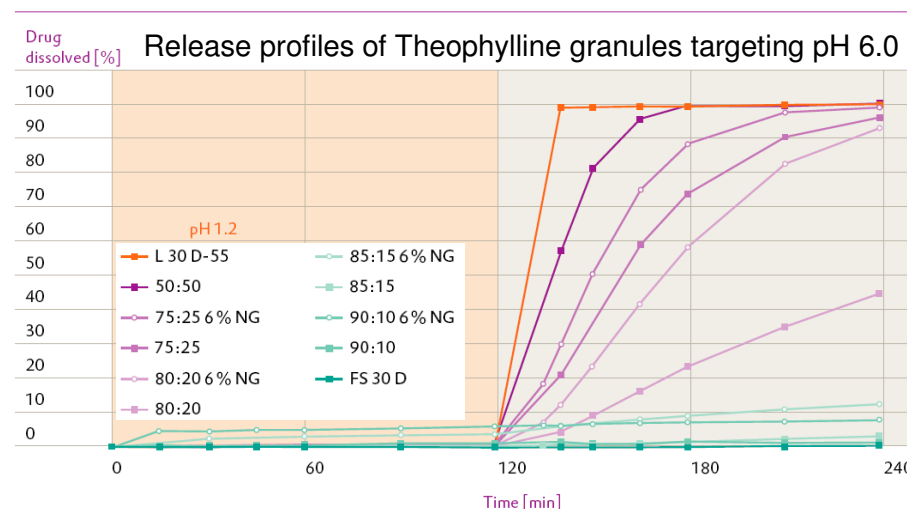
固含量: 20.0%
聚合物含量: 12.8%
聚合物用量: 30.0%

— ► EUDRAGIT® FS 30 D & L 30 D-55 的混合使用，可有效地调整聚合物溶解范围在 pH 6.0 to pH 6.8 之间

不同组合EUDRAGIT® FS 30 D & L 30 D-55的不同表现



- EUDRAGIT® L 30 D-55聚合物为主时，表现为普通肠溶效果
- 当 EUDRAGIT® FS 30 D $\geq 75\%$ 时，表现为缓释效果
- EUDRAGIT® FS 30 D 比例在 85-90% 时，在pH 6介质中开始溶解，在pH 6.5时较慢，在pH 6.8 时药物释放速度加快
- 如果中和部分羧基，释药速度增加



小 结



- **EUDRAGIT® FS 30 D** 是高延展性的聚合物 ($T_g < 50^\circ \text{C}$)
- 可溶解在 **pH 7.0**以上的介质中，特别设计目标为结肠靶向给药
- **EUDRAGIT® FS 30 D** 的骨架片有**pH**非依赖性的特点，可确保药物**100%** 在结肠释放
- 聚合物用量在**10 to 20%** 可制备**pH**非依赖型骨架片
- **EUDRAGIT® FS 30 D**与 **L 30 D-55** 有相似的理化特性，可以任意比例混合
- **EUDRAGIT® FS 30 D**用量 **<50%** 时，对**EUDRAGIT® L 30 D-55**包衣膜的延展性有影响，不影响药物的释放表现，当用量 **> 75%** 时可选择性的控制药物在肠道内的释放部位。

更多信息可登陆: www.pharma-polymers.com



EVONIK
INDUSTRIES