

【工艺】防潮型薄膜包衣系统对阿莫西林/ 克拉维酸片剂稳定性的影响

中国医药工业杂志 前天

防潮型薄膜包衣系统对阿莫西林/ 克拉维酸片剂稳定性的影响

上海卡乐康包衣技术有限公司

(www.colorcon.com.cn)

欧巴代® amb II (Opadry® amb II) 高性能防潮型薄膜包衣系统可保护湿度敏感型剂型产品稳定性受到固体制剂研发和生产时所有因素的影响, 包括片芯处方, 辅料选择, 生产条件, 包装以及终端用户的储存条件等因素。薄膜包衣可以保护片剂不受环境因素比如湿度, 光线, 或氧气的影响, 同时也能提高产品的辨识度以及患者的依从性。

剂型设计与生产影响产品稳定性(图1)



图 1

内包装和干燥剂被认为是剂型不受环境影响最有效的防护手段, 而专门的薄膜包衣系统如欧巴代 amb II 可提供更深层次的防潮保护, 如以下研究案例所示。

薄膜包衣系统可以保护敏感化合物在包装之前不受温度和湿度波动的影响, 包括半成品的贮存、运输或再包装等情况。

在温湿度波动和半成品贮存、运输或再包装期间, 使用中的产品通过完整性测试可以保证在内包装前或从内包装中取出后的产品质量。当药剂师、护理人员或患者配药时, 往往对药物剂型的贮存条件考虑有限。当剂型从内包装取出后, 薄膜包衣就有助于保护剂型的完整性。

防潮型薄膜包衣系统对阿莫西林/ 克拉维酸片剂稳定性的影响

阿莫西林和克拉维酸合用可以针对某些阿莫西林耐药菌产生一种更为广谱的抗菌作用。由于克拉维酸对湿度高度敏感, 所以选用阿莫西林和克拉维酸复方来研究欧巴代 amb II 的防潮性能。这种抗菌药物复方产品通常使用基于羟丙甲纤维素(HPMC) 的薄膜包衣系统进行包衣。

1 在使用中的产品完整性

将未包衣的阿莫西林/ 克拉维酸片芯与 HPMC 为基质的标准型薄膜包衣片和欧巴代 amb II 水性防潮型薄膜包衣片进行药品使用期间稳定性的比较。

将未包衣和已包衣的片剂从内包装中取出，放到消费者常用片剂盒内，按照规定的10 d 给药方案盒子贮存于25℃ /60%相对湿度(RH) 条件下。每天将片剂从盒中取出，按照美国药典所规定的方法测定每种药物成分的含量。

研究结果(图2) 显示，未包衣的片剂和HPMC的包衣片中克拉维酸明显降解。在10 d 给药方案结束时，阿莫西林含量比初始含量下降了20%，但仍在美国药典的含量标准90% ~ 120%范围内。与此相反，克拉维酸含量在10 d 给药方案结束时已经完全降解；然而，使用欧巴代 amb II 的包衣片含量还保持在可接受的水平。由此证明，应用欧巴代 amb II 包衣系统可以提高片剂稳定性，甚至是从内包装里取出的片剂。

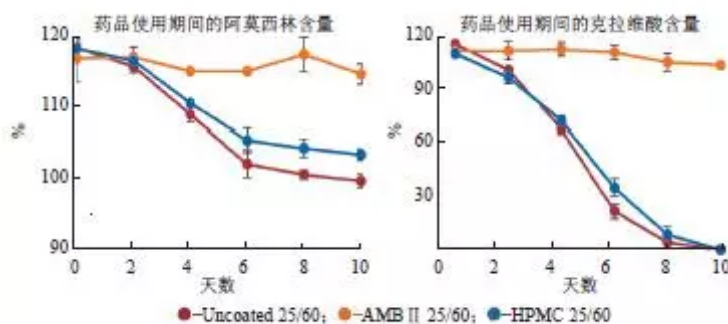


图2 不同片剂的稳定性试验结果

2 多种包装形式下的加速稳定性试验

通过第二个研究案例来确定欧巴代 amb II 防潮型包衣系统对相同的阿莫西林/ 克拉维酸片剂在长期稳定性(加速试验) 中的影响。使用各种各样的商业配置包括Aclar® 乙烯泡罩、铝箔泡罩(AA) 以及HDPE 聚乙烯瓶(含干燥剂) 来包装未包衣和已包衣的片剂，包装好的片剂在40℃ /75% RH 条件下贮存 6 个月。

6 个月后，所有包装里的片剂符合美国药典阿莫西林的含量限度(90% ~ 120%)。欧巴代 amb II 的包衣片相比较于 HPMC 的包衣片和未包衣的片芯，阿莫西林含量要高出 5%。欧巴代 amb II 薄膜包衣对克拉维酸稳定性的影响是明显的。

无论是哪种包装形式，在6 个月的加速稳定性试验后，HPMC 的包衣片和未包衣的片芯中克拉维酸的含量均已下降到可接受水平以下。这些结果证明，欧巴代 amb II 的包衣片保持了剂型的完整性，而 HPMC 的包衣片和未包衣的片芯则无法保持剂型的完整性(图3)。

结果证实，除内包装外，欧巴代 amb II 可以保护对湿度敏感的化合物的完整性。

- 高效全配方水性薄膜包衣系统
- 减少杂质或过敏原问题—— 不含聚乙二醇(PEG) 或大豆卵磷脂
- 批准用于全世界制药用途
- 批准用于全世界制药用途

