

高效崩解剂对提高普乐安片质量的研究

姚建龙(兰溪 321100 浙江康恩贝制药股份有限公司)

普乐安片是以特种花粉制成的薄膜衣片,用于前列腺炎、前列腺增生。其主要成分花粉为纤维性物质,可压性较差,且含量高(80%以上),通常以高粘合性的糖浆为粘合剂,以较大压力压片,以避免出现松片和硬度过低。但因此也带来了崩解时限较长的问题(片芯为30~40min,包衣片为40~50min),影响药物的吸收速度。

交联羧甲基纤维素钠(CMC-Na)、羧甲淀粉钠(CMS-

Na)、低取代羟丙纤维素(L-HPC)和交联聚乙烯吡咯烷酮(交联PVP)是近年国内外应用较多的高效崩解剂^[1-3];聚乙烯吡咯烷酮(PVP)则是一种粘合力强、有利于片剂崩解、溶出的新型粘合剂^[4]。本文通过考察颗粒质量、片剂硬度、崩解时限等指标,研究了上述新型辅料对提高普乐安片质量的作用。

1. 仪器和材料

ZB-LB型智能崩解仪(天津大学精密仪器厂),片剂

四用仪(上海黄河制药厂)。

花粉(青海),CMS-Na,CMC-Na,L-HPC(浙江湖州食品化工联合公司),PVP[国际特品(香港)有限公司],微晶纤维素(山东聊城制药厂)。

2 实验方法

2.1 处方设计

应用微晶纤维素为填充剂;加入高效崩解剂;考虑到花粉的可压性差,以10%PVP胶浆作粘合剂。各处方组成见表1。

表1 处方组成(mg/片)

组分	1	2	3	4
花粉	500	500	500	500
微晶纤维素	30	30	30	30
蔗糖	20	20	20	20
交联 CMC-Na	40			
CMS-Na		40		
L-HPC			40	
交联 PVP				40
10%PVP浆	适量	适量	适量	适量
硬脂酸镁	1%	1%	1%	1%

2.2 制备

将处方量的药物与微晶纤维素、蔗糖粉、崩解剂混合均匀,加入10%PVP胶浆制成软材,以12目筛制粒,在50~60℃干燥,整粒,加入硬脂酸镁混匀,压片。观察颗粒性状,测定片剂的硬度、崩解时限。

3 结果与讨论

3.1 各处方的硬度、崩解时限、颗粒性状

各处方的结果见表2。处方2和3的崩解时限均在20min以内,其颗粒性状和硬度均较好;处方1的片

剂硬度较差,达不到预定5kg的指标;处方4的崩解时限超过20min,颗粒稍硬,片子光洁度不如处方2,3。处方1,4予以淘汰。

表2 各处方的硬度、崩解时限和颗粒性状

测定项目	1	2	3	4
硬度	4.5	7.5	7.1	8.4
崩解时限 (37℃,min)	未测定	18	16	23
颗粒性状	疏松	疏松	疏松	稍硬

3.2 有关问题

因花粉可压性差,以常用的5%PVP作粘合剂粘接力过小,片剂硬度不够。本文以10%PVP作粘合剂,并以少量糖粉作辅助粘合剂既可增加片剂硬,又可减少PVP的用量。普乐安片中,高效崩解剂的用量在35mg/片以下时,作用大大降低,本文选用40mg/片。

4 结论

高效崩解剂L-HPC,CMS-Na和高效崩解粘合剂PVP对提高普乐安片的质量效果明显。崩解显著加快,制成的颗粒完整,片子光洁,硬度能够满足包衣的需要。

参考文献

- 1 沈慧凤,任麒.药用崩解剂性能比较及应用.中国医药工业杂志,1997,28:539.
- 2 王学亮,方晓玲,杨敏,等.高效崩解剂对提高盐酸福明片剂质量的研究[J].中国药学杂志,1998,33(7):434.
- 3 方晓玲,等.几种新型辅料在速释片剂中的应用.中国医药工业杂志,2000,31(6):257.
- 4 平其能,郑梁元.药用聚合物的理论与实践[M].北京:中国科技出版社,1994:329.