

药用新辅料LS-HPL在安宁片中的应用

宁波制药厂 郭勉达 邢虹玲* 熊爱珍*

安宁(甲丙氨酯)片为一安定药,在原生产工艺中,制颗粒时必须采用两次投料的方法来减少淀粉浆的用量以改善崩解度。该工艺操作繁琐,且空气中用丙氨酯粉尘浓度大,严重影响操作工人的健康、药片质量不稳定,时有崩解超限的现象,片子的硬度一般

只有3—4公斤。为了解决以上问题,我们在安宁片的处方中使用了(新型药用辅料—低取代羟丙基纤维素LS-HPL)。按使用方法和数量、设计了六种工艺处方、各处方中主药甲丙氨酯均采用一次投入的方法。处方设计和质量测定结果见表一。

每千片用量(g)	试 号					
	1	2	3	4	5	6
甲丙氨酯	200	200	200	200	200	200
淀 粉	35	35	35	35	35	35
冲浆用淀粉	26	18	18	18	18	18
硬脂酸镁	5	5	5	5	5	5
LS-HPL 内 加	—	—	—	4(2%)*	4(2%)*	4(2%)*
LS-HPL 外 加	—	4(2%)*	6(3%)*	—	2(1%)*	4(2%)*
硬度(均数, kg/片)	4.4	4.6	4.9	4.7	4.7	5.9
崩解度(均数, 秒)	2340	150	90	900	360	210
崩解状况	片 块 状	乳 状	乳 状	乳 状	乳 状	乳 状

* 括号中数字为LS-HPL的用量对甲丙氨酯的百分比。

由上表可见,安宁片中加入了LS-HPL后,片子硬度增加,崩解速度大大加快,且崩解后溶液呈乳状混浊,有利于提高生物利用度。一般加入主药含量2~3%的LS-HPL就可收到明显效果。

讨 论:

1. 在改善硬度方面,内加法(即在制湿颗粒时加入)的效果比较明显,这是因为内加时LS-HPL与药粉和颗粒间相嵌的机会更多、因而结合得更加牢固。

2. 在改善药片的崩解度方面,外加法(即在整理干颗粒时加入)比内加法更为有效、这是由于外加的LS-HPL粉末与水的接触面积比较大,所以吸湿快、吸水量大。

在生产中我们选择了外加2% LS-HPL这一工艺,因为这一工艺对改善崩解度效果显著、药片比原来硬,对成本的影响较小(每100片安宁片只提高成本八厘钱)。另外,由于采用主药一次投入的方法,所以减轻了粉尘飞扬的程度,有利于保护工人身体健康。