

【分享】聚苯乙烯磺酸钠在缓控释制剂中的应用

优普惠 2022-09-01 13:56 发表于广东



英国漂莱特 (Purolite) 集团成立于1981年，是目前世界上规模前几的离子交换树脂生产、研发和市场开拓的专业跨国集团公司。集团现共有四个生产基地，分别设在英国、美国、罗马尼亚及中国，拥有500多种产品，年生产离子交换树脂6万余吨。

漂莱特生产的离子交换树脂（见表1）是一种遇水溶胀，不溶于水的高分子聚合物，由功能团和非活性基团构成。在药物制剂中用作活性药物成分（API）或赋形剂。符合USP、Ph.Eur、BP和JP的要求，主要用于医药、食品、水处理、环保、化工、生命科学等领域。

表1.离子交换树脂产品

型号	DMF	登记号	特性
聚克立林钾 (原波拉克林钾) C115KMR/5100	7940	F20210000083	离子交换容量 10eq/kg, 粒径 75-150 μ m, 弱酸型, 超级崩解剂, 掩味、缓释材料。
聚克立林 C115H MR	/	/	离子交换容量 10eq/kg, 弱酸型
消胆胺 A430 MR	7324	/	强碱阴离子交换树脂, 原料药
聚苯乙烯磺酸钠 C100NaMRNS	5882	/	K ⁺ 交换容量 2.8-3.4meq/g, 强酸型, 掩味剂, 用于缓控释, 原料药
聚苯乙烯磺酸钙 C100CaMRNS	/	/	K ⁺ 交换容量 1.3-2meq/g, 强酸型, 原料药

今天为大家介绍的是可作为缓控释、掩味剂的产品聚苯乙烯磺酸钠C100NaMRNS。

产品档案

【名称】聚苯乙烯磺酸钠

【型号】C100NaMRNS

【性状】无味的浅黄色粉末

【生厂商】Purolite 漂莱特

【标准】USP, EP, BP, JP

【DMF号】5882

【离子形态】Na型

【官能团】磺酸基

【包装规格】25kg/桶

【有效期】60个月

【贮存】密闭，于阴凉干燥处贮藏

【应用】缓控释、掩味剂、API

【结构】

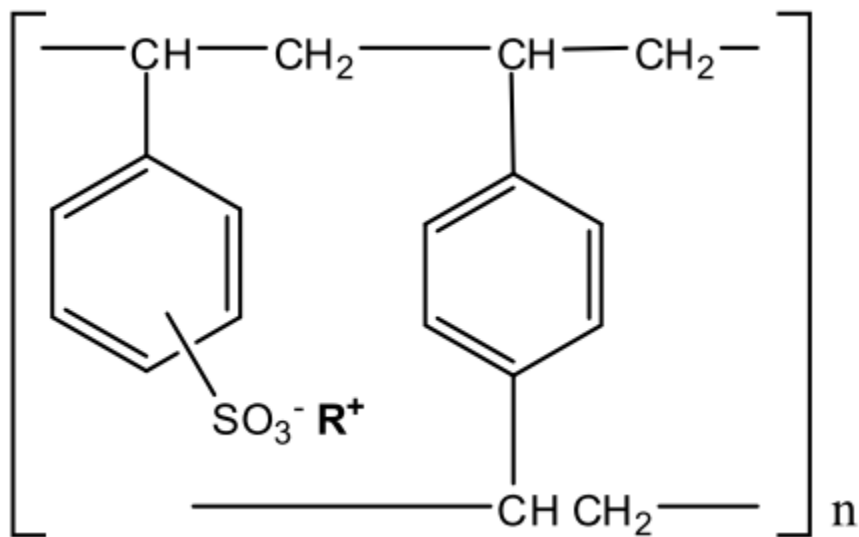


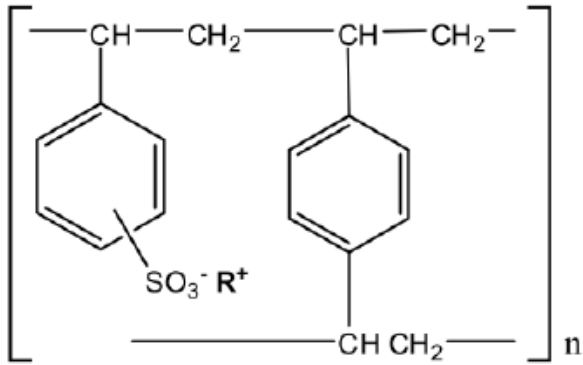
图1.聚苯乙烯磺酸钠/钙结构

【功能用途】

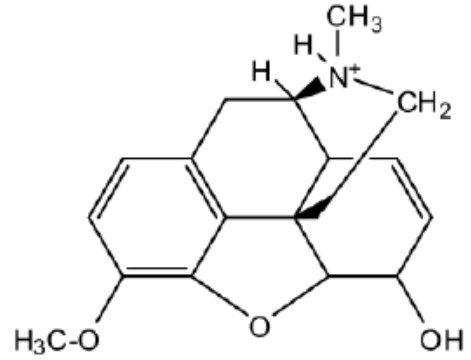
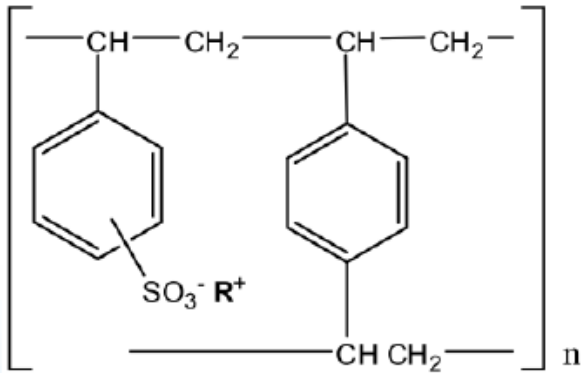
- 不溶性强酸型 ($\text{—SO}_3\text{H}$) 的阳离子交换树脂，为干燥细微颗粒。聚苯乙烯磺酸钠可作为碱性药物的载体，采用合适的包衣技术，还可用于缓控释制剂。
- 将API结合到磺酸基团后，可以掩盖药物的味道，而且形成药物树脂盐复合物可以控制药物释放。复合物在体内高电解质胃肠道环境中达到平衡后，开始释放药物。
- C100NaMRNS用作活性成分时，用来治疗急慢性肾功能不全和肾透析患者的高血钾症

案例分析

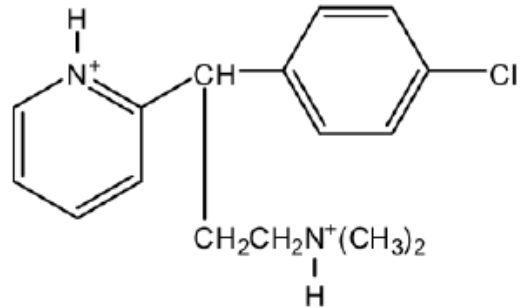
复方可待因氯苯那敏缓释混悬液



Tuzistra™ XR



R²⁺



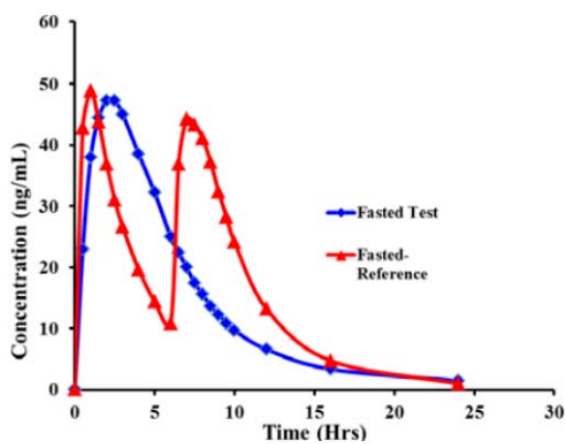
处方组成

处方组成	辅料名称	作用	厂家
缓释颗粒	聚苯乙烯磺酸钠 C100Na MRNS	离子交换	漂莱特
	聚维酮 K29/32	稳定剂	亚什兰
	聚乙酸乙烯酯	包衣材料	/
	三醋汀	增塑剂	/
	吐温 80	表面活性剂	/
助悬部分	微晶纤维素羧甲纤维素钠	助悬剂	东辰制药
	柠檬酸	金属离子络合物	/
	蔗糖	甜味剂	/
	甘油	润湿剂	/

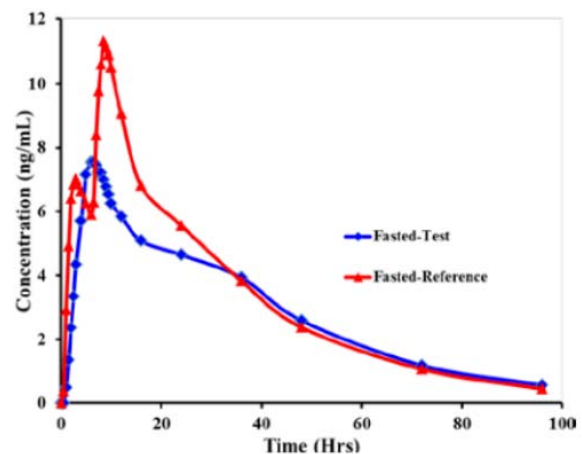
① Tuzistra™ XR是美国市场上12小时给药一次的复方缓释混悬液

② 2009年1月，UCB Inc申请Codeprex™ Pennkinetic® 撤市

③ 2015年4月，VERNALIS 的Tuzistra™ XR获批上市（采用Tris公司的Oral XR缓释技术，Tris公司2010年上市可乐定缓释混悬液，2013年上市卡比沙明缓释混悬液，2015年10月上市安非他明缓释混悬液），采用的都是C100NaMRNS作为离子交换。



没加C100NaMRNS前



加入C100NaMRNS后

➤➤➤ C100NaMRNS与API结合后，形成药物树脂盐复合物可以控制药物释放，使用C100NaMRNS后的缓控释效果要明显优于对照组。

应用举例

可待因	氯苯那敏
安非他明	可乐定
氢可酮	右美沙芬
文拉法辛	帕罗西汀
索利那新	二甲双胍

样品申请

深圳市优普惠专业经营进口API&药用辅料及应用推广22年。代理的产品涵盖东辰、Budenheim、SPI、亚什兰、大丰胶囊、Vikram、CEAMSA、索尔维（Solvay）、伊士曼、沙索、卡博特、漂莱特、Berry等国际一流辅料企业品牌，三十多大类，近千个品种的高品质药用辅料、原料药、药用包材等系列产品。其中包括关键性注射级辅料和高品质口服制剂辅料等，广泛应用于片剂、胶囊剂、混悬剂和注射剂等制剂中。

欢迎关注“优普惠”公众号获取更多产品信息，众多产品和资讯总有您需要的，也可扫描下方二维码免费申请样品，赶快行动吧！



扫描二维码申请样品



优普惠

专注新型功能性药用辅料！

25篇原创内容

公众号

文章已于2022-09-01修改