

儿童新剂型-如何优化咀嚼片适口性

优普惠 2022-12-23 08:53 发表于广东

收录于合集

#儿童

1个



上篇文章（儿童新剂型开发-口腔崩解微片(ODMTs)），我们说到了口腔崩解微片是一种专为儿童设计的新剂型，除了增强吞咽能力外，还可以按重量精确给药、剂量调整、快速崩解，并可能增强溶出度，克服一些可替代的、不方便的剂型（如糖浆和混悬剂）带来的一些剂量挑战。

对儿童来说，咀嚼片也比传统片剂更有吸引力，可以实现足够的适口性。

下面为大家展示的是为儿童设计的另一个新配方例子，由包衣掩味颗粒制成的“微调”咀嚼片剂的概念证明（Proof of Concept,简称POC），以及如何优化儿科配方的口味。

案例分析

咀嚼片POC目的和目标

在开发咀嚼片剂配方时有许多考虑因素，为了确保依从性和成功的治疗结果，适口性对儿科患者尤为重要。许多药物本质上是苦的，有些药物是用柠檬酸等弱酸一起配制的，以达到矫味、矫色的目的，或通过改变局部pH值来增强药物溶解。制剂的化学性质可能会对API掩味系统的功能产生不利影响，从而影响制剂的适口性。

下面我们进行了一项筛选研究，目的是开发一种优化的咀嚼片剂配方，该配方含有活性成分愈创甘油醚 (Gui)和右美沙芬(Dex)。用品尝味觉评估的方法确定哪些配方在掩味和感官属性方面最可口。

咀嚼片POC材料和方法

将含有固定剂量组合 (FDC) 的掩味颗粒 (含Gui和Dex) ，用反向肠溶聚合物包衣 (pH≤5溶解) ，配制成六种咀嚼片配方。配方1-5含有弱果酸和柑橘类调味剂。配方6含有薄荷和薄荷醇，不含酸成分。配方中FDC(含200mg Gui和7.3mg Dex)占比49%。试验配方如表4所示。

表4.片剂配方

Formulation	1	2	3	4	5	6
GUI/DEX Taste Masked beads (%w/w)	49	49	49	49	49	49
Microcrystalline Cellulose PH 102 (%w/w)	15	10	10	10	10	10
Copovidone (%w/w)	3.0	3.0	1.0	1.0	3.0	3.0
Silicon Dioxide (%w/w)	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
Crospovidone XL (%w/w)	5.0	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5
Sucralose (%w/w)	1.0	1.5	1.5	1.5	1.5	1.5
Lubripharm SSF (%w/w)	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5
Lemon and Lime flavor (%w/w)	2.0					
Orange Flavor (%w/w)		2.0	3.0	3.0	3.0	
Peppermint flavor (%w/w)						2.0
Citric Acid (%w/w)	1.0	1.0				
Tartaric Acid (%w/w)			1.0	1.0	2.0	
Menthol (%w/w)						1.0
Mannogem® EZ (%w/w)	QS to 100	QS to 100	QS to 100	QS to 100	QS to 100	QS to 100

将含有活性成分的颗粒和赋形剂在一起混合15分钟，并在Rimek Mini press-II SF压片机上将最终混合物压制成片重1200mg的片子。

结果与讨论

每种配方都由品尝小组评估其适口性，发现含有柑橘香料与柠檬酸或酒石酸组合的配方1-5有苦味和不可接受的味道，含有薄荷和薄荷醇但不含酸性成分的配方6是可接受的味道，无苦味。

含有酸的片剂（配方1-5）在20ml水中溶解后，其pH值约为4.3，而不含酸化剂的配方6的pH值 ≥ 8 。这可能是配方1-5显苦味，而配方6无苦味的原因。因为配方1-5中的反向肠溶聚合物包衣膜在较低pH下部分溶解，释放了部分Gui和Dex颗粒，从而尝出苦味。而配方6不含酸，包衣膜未被破坏，从而不会显示苦味。

在品尝小组评估之后，又进行了另外三个试验以确定酸度是否主要由酸性成分引起或柑橘香料引起。从其基础处方中去除酸性成分，在没有酸成分的情况下压制成含有柑橘风味的片剂，测量并确定pH值约为7.8。

从这些结果可以得出结论，柑橘类香料对pH值没有影响，之前看到的较低pH值是由于酸性成分造成的。基于这些结果，配方设计师开发了不含酸成分的咀嚼片，具有良好的适口性且无苦味。

总结

咀嚼片研究表明，配方设计师必须仔细考虑有助于该剂型最终适口性的所有配方组成，在配方开发的同时利用品尝味觉评估可能会很有启发，使用品尝味觉评估来发现潜在的感官问题并帮助指导配方决策。

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、KERRY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



点分享



点点赞



点在看

喜欢此内容的人还喜欢

全国安全用药月 | 急性心梗不要慌，这些措施能救命！

药葫芦娃



安全用药月 | 儿童化妆品也能吃吗？

北京东城区市场监管



【昆华药师】利奈唑胺治疗药物监测与个体化给药

昆华药师

