

用于缓释配方-DRUGCOAT®RL/RS

优普惠 2022-08-12 07:31 发表于广东



印度Vikram生产的DRUGCOAT® RL、RS系列（丙烯酸酯和甲基丙烯酸的共聚物）主要用于口服固体制剂缓释包衣的成膜剂，同时也可用于湿法制粒的粘合剂，从而实现药物的缓释或控释释放。现在人们逐渐意识到，很多药物不需要在食用后立即完全释放，持续的药物释放可以更有效的控制疾病的发展，RL、RS系列聚合物对开发缓释制剂的给药系统至关重要。

DRUGCOAT® RL、RS系列有多种不同的物理形态，分为颗粒、粉末和有机溶液。其主要特点有：RL系列季铵基含量高，铵基以盐的形式存在并使聚合物具有相对较高的渗透性，RS系列季铵基含量低，铵基团以盐的形式存在并使聚合物具有相对较低的渗透性。

RL、RS系列具有以下优点：

- 用于API缓释
- 自定义释放功能
- 延长有效血药浓度
- 总剂量的减少
- 降低剂量倾卸风险
- 降低API的毒性作用
- 减少给药频率
- 提高患者顺应性

今天为大家介绍的是可作为缓释骨架材料、包衣掩味材料、粘合剂的 RL100和RS100。

产品档案

【名称】氨基甲基丙烯酸酯共聚物A型、B型

【型号】DRUGCOAT® RL、RS

【性状】白色至淡黄色颗粒

【生厂商】Vikram威克朗

【CAS号】33434-24-1

【标准】USP/NF , Ph. Eur.

【分子量】约35,000Da

【玻璃化转变温度 (Tg)】65°C

【粘度】1-15mPa.s

【干燥失重】≤3.0%

【包装规格】10kg/桶

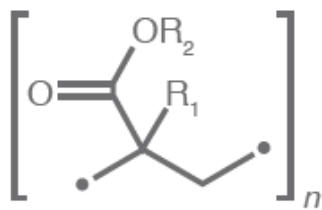
【有效期】60个月

【贮存】保存在密封容器中，在低于30°C的温度下储存

【应用】缓释骨架材料、包衣掩味材料、粘合剂

【结构】

RL100结构式

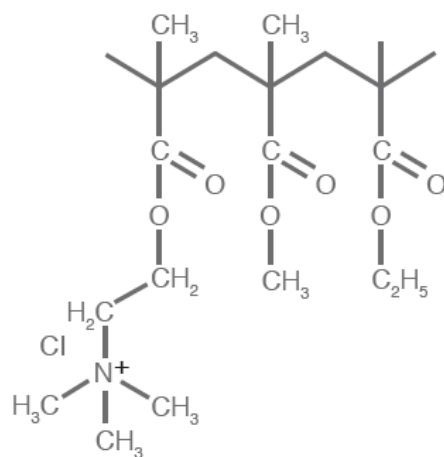


$R_1 = \text{CH}_3; R_2 = \text{CH}_3$ or

$R_1 = \text{H}; R_2 = \text{C}_2\text{H}_5$ or

$R_1 = \text{CH}_3; R_2 = \text{*} \text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{N}^+(\text{CH}_3)_3$

RS100结构式



【性能】

型号	物理形态	登记号	溶解性质	特性
RL 100	颗粒	正在准备	pH 非依赖性	氨基甲基丙烯酸酯共聚物 A 型，不溶解，高渗透性，缓释骨架材料
RS 100	颗粒	正在准备	pH 非依赖性	氨基甲基丙烯酸酯共聚物 B 型，不溶解，低渗透性，缓释骨架，包衣掩味材料

应用示例

双氯芬酸钠缓释片

表 1. 双氯芬酸钠缓释片配方

成分	重量 (每片)	厂家	作用	参数
双氯芬酸钠	100mg	/	干混	形状：标准 尺寸：8mm 平均重量：250mg 硬度：12kg/cm ² 厚度：4.45mm
微晶纤维素	134mg	东辰制药		
DRUGCOAT® RL100	10mg	Vikram	粘合	
DRUGCOAT® RS100	2mg			
丙酮	48mg	/		
胶态二氧化硅	2mg	卡博特	润滑	
硬脂酸镁	2mg	/		
总计	250mg			

方法

- 采用湿法制粒制备每片含100mg双氯芬酸钠缓释片，分别称取处方量的各辅料，并过60目筛；
- 将双氯芬酸钠和微晶纤维素混合均匀；
- 将RL100和RS100溶解在丙酮中，搅拌直至澄清溶液；
- 在湿法制粒机中，用上述聚合物溶液将干混粉（双氯芬酸钠/微晶纤维素）制成湿颗粒，湿颗粒通过18目筛整粒；
- 将制备好的湿颗粒均匀的铺在托盘烘干机中，室温干燥；
- 将干燥后的颗粒过16目筛整粒，以获得尺寸均匀的干颗粒；

- 用胶态二氧化硅和硬脂酸镁对干颗粒进行润滑；
- 使用上述参数的旋转压片机（Proton，印度）将润滑后的颗粒进行压片，即得。

结果：

依据USP检验II标准，研究了双氯芬酸钠缓释骨架片中双氯芬酸钠的释放百分比。通过与标准校准曲线比较，在275.5nm波长下，用分光光度法测定缓释骨架片样品中双氯芬酸钠的释放量，图1所示。

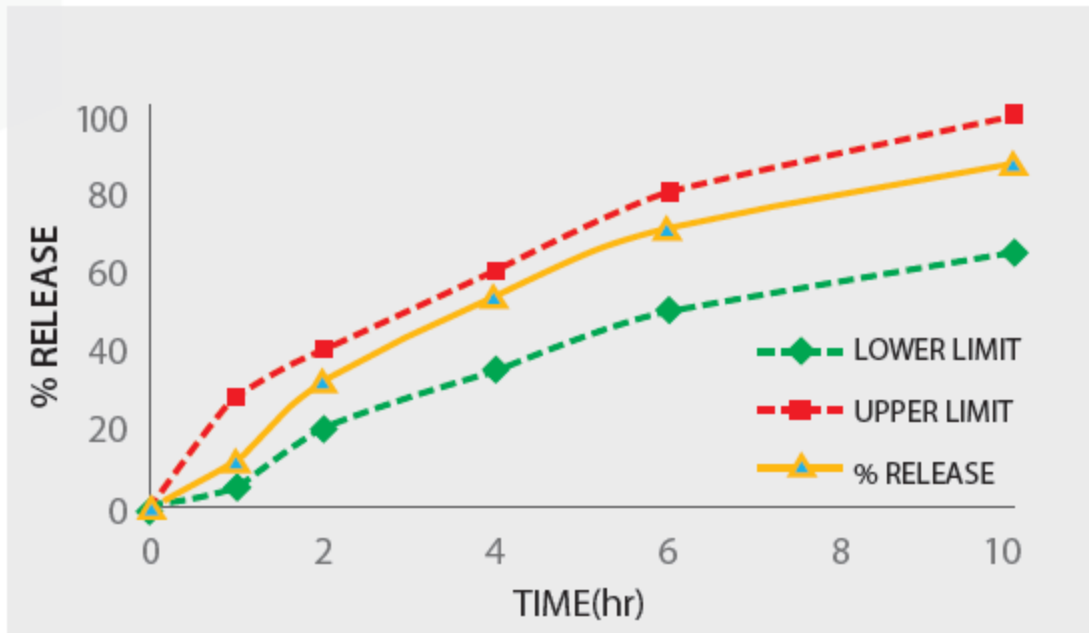


图1.双氯芬酸钠缓释片体内释放曲线

注：

- DRUGCOAT®RL和RS可以以不同的组合比例使用，以实现不同的释放曲线；
- 一般来说，与RL系列聚合物相比，RS系列聚合物更容易延迟；
- RL和RS也可用作口服固体制剂的包衣剂，得到缓控释制剂。

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
YU HUI HUI
YU HUI HUI
YU HUI HUI

喜欢此内容的人还喜欢

【新生专栏】来英国要不要带药品？

伦敦全知道



2021北京医学会风湿病学分会年会讲座视频第31期

北京医学会风湿病学分会



现场常见安全隐患检查要点，图文对照！

河南微安全



