

崩散劑功能性參數之評估 - 打錠壓力對溼潤與崩散之影響 Evaluation of Functional Parameters of a Disintegrant - Effect of Compression Pressure on the Disintegration and wetting

羅光廷², 陳俊仁^{1*}

1. 嘉南藥理科技大學藥學系
2. 嘉南藥理科技大學藥物科技研究所

摘要

背景與目的：對於固體劑型的藥品來說，所含的活性成分必須先經過崩散或溶離等步驟之後才會釋出，接著穿透過黏膜進入血流，到達作用部位產生藥效。對於低溶解度的藥品，崩散後所形成的小碎片會增加與溶媒接觸的表面積，有助於藥物的溶離，因此加入的崩散劑種類、多寡對於溶離皆有影響。一般認為，崩散劑的功能包括以下兩種：吸水與膨脹，但吸水的過程是主導崩散劑顆粒在崩散行為的必要條件，本研究的目的是希望能建立一個方便而簡易的參數及測量方式，來測定且比較各種崩散劑的崩散能力。

方法：本次研究採用了三種常見的崩散劑：交聯性的羧甲基纖維素鈉（商品名是Ac-Di-Sol®）、交聯性的乙烯基吡咯烷酮（商品名Polyplasdone XL®）、羧甲基澱粉鈉（商品名是Primojel®），以水溶性的Acetaminophen（乙醯胺酚）作為模型藥物，加入磷酸二鈣（商品名是Di-Tab®）作為賦型劑，採用直接壓錠法，以不同的打錠壓力進行製錠，處方中崩散劑的用量以常用量為主，崩散試驗則是根據美國藥典(USP XXX)的規範以崩散試驗機進行。濕潤性試驗是採用一個直徑9.5 cm培養皿，覆上均勻佈滿孔徑2 mm小洞的壓克力片（直徑為4 cm，厚度是4 mm），注入適量的水之後，再蓋上一層濾紙，使整個供水裝置成為一個連動的系統，即錠劑的水份供給不受阻礙，持續供給水份，濾紙與壓克力片間不能有氣泡干擾，再把錠劑放入，觀察錠劑吸水膨脹之後，高度與直徑的變化。利用此裝置探討打錠壓力與崩散及濕潤之間的關係。

結果：當打錠壓力增加，錠劑的濕潤與崩散所需要的時間也隨著增加。整體而言，含有交聯性的羧甲基纖維素鈉（商品名Ac-Di-Sol®）與羧甲基澱粉鈉（商品名Primojel®）的錠劑，所需要的時間比含有交聯聚乙烯基吡咯烷酮（商品名Polyplasdone XL）作為崩散劑之錠劑來的短。

Keywords: Disintegration, wetting