

口服固体制剂用辅料：创新与挑战

[片剂和胶囊] 杂志 2024 年 6 月 1 日 访谈摘要

固体制剂是药物输送系统的常用方式。受到患者和医疗服务提供者的青睐，因为它们方便使用、剂量准确且经济实惠。然而，这些固体制剂的有效性不仅仅取决于其活性药物成分（APIs），药用辅料也扮演着至关重要的角色，与活性成分一同配制，共同助力创造有效稳定且患者友好的药物。

辅料不是简单的填充物；它们提升治疗效果，调整药物释放，确保稳定性，并改善药物口感。它们在制造过程中扮演关键角色，影响产品整体性能和可接受性。

此外，随着药物开发的不断演变，辅料的作用变得愈发复杂和关键。辅料技术的创新为应对新型和高活性 API 相关的配方挑战开辟了新的途径。制药行业正朝着更复杂的药物递送机制的方向发展，进一步突显了辅料的重要性。

本文将探讨固体制剂中辅料的多面角色，展现技术的进步以及当前面临的挑战，同时融入制药行业专业人士的访谈见解。通过这一探索，我们将揭示现代辅料如何为未来的药物递送和患者护理创新奠定基础。

药用辅料技术的进步

最近几年，药用辅料行业在技术方面取得了显著进步，主要旨在提高药物配方的能力，并解决与 API 传递相关的特定挑战。这些创新对于提高药物的功效、安全性和患者依从性至关重要，在药品成功的过程中发挥着关键作用。

卡乐康的全球业务经理 **Russell Prestipino** 分享了他的想法：“这些新技术的最终价值在于改善产品的质量和功效。通常情况下，辅料与 API 之间的相互作用推动了新技术的改进。我们如何提高活性物质的生物利用度，同时减少剂型的大小？生产过程是否可以更加高效，我们是否可以根据需要增加药品的生产？这两个问题都受益于技术的进步，但如果没有辅料提供的特定质量属性，这些问题将无法实现。”

提高药物溶解度

在制药开发中，一个紧迫的问题是许多新化合物的水溶解度较低。**Kerry** 的产品经理 **Chandan Kaiwar** 提供了以下示例，说明辅料如何改善药物的溶解度和生物利用率：

溶解： 辅料如表面活性剂和共溶剂通过形成胶束或溶解药物分子来增强药物的溶解度。

粒径减小： 聚合物或表面活性剂等辅料减小药物颗粒大小，增加可溶解和吸收的表面积。

络合作用： 环糊精等辅料与溶解度较差的药物形成包含复合物，提高其溶解度和溶解速率。

无定形固体分散： 聚合物等辅料制备无定形固体分散，防止药物结晶并促进快速溶解。

pH 调节： 缓冲剂等辅料改变胃肠道 pH 值，在特定部位优化药物溶解度和吸收。

共处理辅料

共处理辅料代表着制药配方技术的重大进步，旨在解决传统辅料的局限性，同时优化药物的生产过程并提高药品质量。这些复合颗粒是由物理处理两种或两种以上的辅料形成的，以获得比单一成分简单物理混合更优越的特性。

使用共处理辅料的主要优势在于增强配方的功能性。它们可以提高可压性，增强流动性，并提高 API 的溶解特性。例如，结合超速溶剂和填充剂的共处理产品可能表现出更高的片剂崩解速度，同时不会降低片剂的硬度或可压性，从而增强 API 的功效。

“我们注意到人们对共处理辅料（CPEs）的兴趣不断增加，这主要是因为它们为制造商提供了多重好处，例如提高制造效率。” Innophos 的高级业务经理 John Gilligan 表示，“CPEs 通常减少了配方所需的成分数量，导致库存水平降低，质量控制检查和批准次数减少，并且时间缩短。此外，还可以实现改善片剂完整性、可压性和排出特性等。减少成分后，标签更干净，片剂通常更小，这是消费者所喜欢的。”

总的来说，辅料技术的不断发展拓宽了可治疗疾病的范围，显著影响了疗法的成本效益。像 Russell Prestipino、Chandan Kaiwar 和 John Gilligan 这样的行业专业人士所说，这些技术的转型的影响不仅在提高药物性能方面，还在简化生产流程方面。

当前面临的挑战

尽管辅料技术近年来取得了显著进展，但仍然存在一些挑战，需要持续的研究和创新来克服。这些挑战涉及制剂开发、生产、法规合规性和市场需求等各个方面。

稳定性问题

药物配方在有效期内能否保持稳定对于确保产品的功效和安全至关重要。辅料可以通过各种机制影响活性药物成分的稳定性，包括降解反应、吸湿和物理相互作用。制剂师必须进行严格的稳定性测试，以识别潜在的稳定性风险，并相应地优化配方组成。

法规合规

药用辅料的法规环境复杂且不断演变。监管机构对药用辅料的质量、安全性和文件要求非常严格。遵守法规指南对市场批准和商业化至关重要，也增加了配方和开发过程的复杂性。

“制药行业面临的法规挑战往往反映了药用辅料制造商所面临的问题。” 卡乐康的全球业务经理 Russell Prestipino 表示，“当前热点问题包括亚硝酸胺、DEG/EG 测试、二氧化钛替代品以及新型药用辅料的使用。这些挑战需要制药制造商与药用辅料供应商之间建立强大的合作伙伴关系，例如各种新兴议题上进行信息共享。快速提供这类信息对于为多个市场提供服务的制造商来说可能具有挑战性，特别是在制药行业只占其整体业务的一小部分的情况下。专注于制药行业的药用辅料制造商通常更适合跟踪行业面临的新问题并做好准备，以满足客户日益增长的需求，并了解他们在配方中使用的材料。成本和供应链管理

辅料的成本可能占据整体生产成本的大部分，尤其是对于高产量产品来说。制剂研究者必须在考虑成本和确保符合法规标准的高质量辅料之间取得平衡。

Kerry 的产品经理 Chandan Kaiwar 发表了关于影响药品生产中辅料使用的供应链问题和趋势的看法：

原材料采购：受地缘政治紧张局势和市场波动的影响，存在可用性、质量和成本方面的挑战。

法规合规：我们需要严格遵守 GMP 和国际标准，以确保辅料的制造、运输和储存符合法规要求。

质量保证：我们始终致力于确保产品的安全性和质量标准，保持整个供应链的完整性。

全球化：考虑到辅料采购和生产的全球性质，我们必须应对物流、合规和质量控制方面的复杂性。

供应链灵活性：我们专注于构建具有灵活性的供应链，能够抵御各种干扰，采取双重采购和风险缓解措施等策略。

可持续发展：我们强调可持续发展实践，包括推动环保工艺和可再生资源的使用，以应对环境担忧和法规压力。

安全性和功效

药物配方中的辅料扮演着至关重要的角色，对药品的安全性、功效和整体表现起着关键作用。然而，确保辅料的安全性和功效对药物的开发和法规批准至关重要。

Innophos 的法规事务经理 Brian Kirkland 提供了一些建议，以确保药物配方中使用的辅料的安全性和功效，“制药公司应根据其产品的预期用途确定适当的法规和 GMP 要求。公司需要获取关于辅料制造商、分销商和辅料本身的信息，作为供应商和辅料资质的一部分。制药公司可以通过以下方式之一来满足这一期望：

与使用第三方审计服务并获得 BRC、ISO 22,000 或 SQF 等审计方案认证的供应商合作。

自行进行审核

经过独立第三方认证机构的现场检查，我们对辅料供应商及其整体供应链进行了审核。

总之，固体剂型配方的构成在很大程度上取决于原料药和辅料之间的协同关系。辅料不仅是填充成分，还是配方成功的积极贡献者，对药物释放动力学、溶解性的增强以及整体药物性能起着重要作用。随着药物开发的不断进步，为迎接新型原料药的挑战，辅料需求不断增长，同时动辅料技术的不断拓展。

然而，尽管存在一些挑战，如稳定性问题、法规合规性和供应链管理等，但这并不意味着没有解决的办法。辅料需要符合法规标准和市场需求，同时也需要在创新和严格的质量控制之间取得平衡。

为了克服这些挑战，制药行业的各方需要展开合作，保持透明。监管机构、辅料供应商和制药生产商必须携手合作，确保制剂的安全、有效和高质量。

通过拥抱技术进步并克服挑战，在塑造药品制剂的未来和改善全球医疗保健方面，辅料行业将继续发挥关键作用。，得到了格列吡嗪推拉式渗透泵片。所制得的片剂（使用可丽释 CA™ 包衣和激光打孔后）显示出良好的零级药物溶出结果。即取即用的全配方的直压型推动层预混辅料可丽释 OPL™ 使用便捷，且能减少与聚氧乙烯相关的清洁负担。此外，采用直接进料的方法能够提供更安全的操作环境以及更高的推拉式渗透泵片的生产效率。

根据我司所知及所信，本文包含的信息真实、准确，但由于方法、条件以及产品设备的差异，故不对产品任何推荐的数据或者建议提供明示或暗示性担保。在贵方的任何用途上，也不作同样的产品适用性担保。我司对意外的利润损失、特殊或相应的损失或损害不承担责任。

卡乐康公司不作任何明示或暗示性担保。即不担保客户在应用卡乐康产品的过程中不会侵犯任何第三方或实体持有的任何商标、商品名称、版权、专利或其他权利。

卡乐康是一家全球公司分布在北美、欧洲、中东、非洲、拉丁美洲、印度和中国。

更多信息请浏览网站：www.colorcon.com.cn



© BPSI Holdings LLC, 2024.
本文所包含信息归卡乐康所有，未经许可不得使用。

* 除了特别指出外，所有商标均属BPSI公司所有

News_Tablet&Capsule_Jun012024_CHN