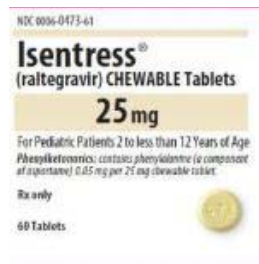


通过薄膜包衣对儿科口服固体制剂进行掩味

苏丽丝®(Surelease®)与欧巴代®(Opadry®)在欧盟地区雷特格韦儿科剂型开发过程中的应用



雷特格韦是由默沙东制药（MSD）开发的抗逆转录病毒药，用于治疗人类获得性免疫缺陷综合征（HIV-1），上市产品的商品名为 ISENTRESS。该产品首先问市的剂型是 400mg 薄膜包衣片，并获得上市许可，2007 年 12 月起在欧盟地区被允许用于治疗成人 HIV-1 感染。

随后默沙东决定开发该药物的儿科配方，设计用于两岁以上儿童的治疗，400mg 片剂不适用于这一领域。出于临床原因，默沙东决定开发 25mg 与 100mg 两种规格。

活性药雷特格韦具有强烈的苦味，所以掩盖这一物质的苦味是这一研发项目的重要组成部分。在制备成最终剂型之前，使用了几种不同的掩味材料对雷特格韦颗粒进行包衣。最终选择的包衣方案由乙基纤维素水分散体苏丽丝（E-7-19040）与基于羟丙甲基纤维素的欧巴代组成。乙基纤维素在水中不溶，通过延缓药物在口腔内的溶出起到掩味作用，同时，欧巴代作为包衣致孔剂，使药物在胃内能迅速释放。

默沙东考虑了一系列的药物最终剂型，包括口崩片与咀嚼片。根据溶出数据及患者问卷调查的结果，最后决定选择咀嚼片。最终的咀嚼片也包含有一种矫味系统，以防咀嚼过程引起部分掩味包衣的破坏。



2012 年 10 月，ISENTRESS 儿科剂型在 2 岁以上儿童中的应用获得欧盟地区人用医药产品委员会的积极评价。

注意：在美国市场也有一种 ISENTRESS 口服干混悬剂，同样包含有苏丽丝。该产品批准用于 4 周以上，体重 3kg 以上的患者。

更多使用薄膜包衣进行掩味包衣的应用可通过如下途径查询：

<http://www.colorcon.com.cn/products-formulation/all-products/film-coatings/sustained-release/surelease>

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。



更多信息请与卡乐康中国联系，电话:+86-21-61982300·传真:+86-21-54422229

www.colorcon.com.cn · marketing_cn@colorcon.com

北美
+1-215-699-7733

欧洲/中东/非洲
+44-(0)-1322-293000

亚太区
+65-6438-0318

拉丁美洲
+54-11-5556-7700

www.colorcon.com

© BPSI Holdings LLC, 2014. 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

WP_Sure_tastemask_Isentress_V1_CHN_0714