

# 应用防潮型薄膜包衣增强片剂使用期间的稳定性

Plinio Sandoval, David Ferrizzi, Jason Teckoe, Charles Cunningham 和 Ali Rajabi-Siahboomi      AAPS  
Colorcon, Inc., Harleysville, PA USA      海报重印 2016

## 目的

药师和患者通常会拆除药品的内包装，再按处方量分装到其他容器中。一旦除去内包装，药品中的活性成分(API)就会失去保护，受到环境的不利影响，API 可能会发生降解。2001 年，欧洲药品管理局(EMA)发布了关于人用药使用期间稳定性试验指南的注解。<sup>1</sup> 该指南建议进行稳定性研究，模拟预测已开封的药品的使用和存放时间，以保障开封后一段时间后药品的质量。基于 EMA 指南，本研究将阿莫西林-克拉维酸固定剂量复方片除去外包装后放入分装瓶，考察了薄膜包衣对该片剂的稳定性的增强作用。

## 方法

阿莫西林与克拉维酸联用可扩大抗菌谱，对一些阿莫西林的耐药菌仍有活性。由于克拉维酸对湿度高度敏感，本研究所选则的是阿莫西林 875mg+克拉维酸 125mg 的复合制剂。将未包衣片剂和用 HPMC 基质的欧巴代® (Opadry®)或 PVA 基质的防潮型欧巴代® amb II(Opadry® amb II)(卡乐康公司)包衣的片剂，包衣增重(WG)均为 4%，在生产过程中包装于 Aclar 的泡罩内。随后将片剂除去内包装(图 1)，放入带铰链盖的多室塑料药品分装盒中，这是许多消费者会使用的药品分装容器。按照实验方案将上述分装盒于 25°C/60%RH 下的恒温恒湿箱(图 2)中放置 10 天。于放置当天及此后每隔 2 天，从分装盒中取样，并根据 USP(美国药典)的方法进行含量测定。

图 1. 除去片剂(欧巴代 amb II 包衣)包装



图 2. 片剂放置条件



## 结果

使用欧巴代 amb II 包衣的样片，在 25°C/60%RH 下放置 10 天后，阿莫西林和克拉维酸的含量符合 USP 的要求。而未包衣和用 HPMC 配方包衣后的样片，在放置开始的 4 天内，克拉维酸均发生明显降解，不符合 UPS 的 90-120% 的含量限度。放置 10 天后，未包衣和用 HPMC 配方包衣后的样片已无克拉维酸剩余，且该两种样片中阿莫西林的含量降低均超过 10%。(图 3 和 4)

图 3. 克拉维酸含量(%)随放置时间(天)的变化

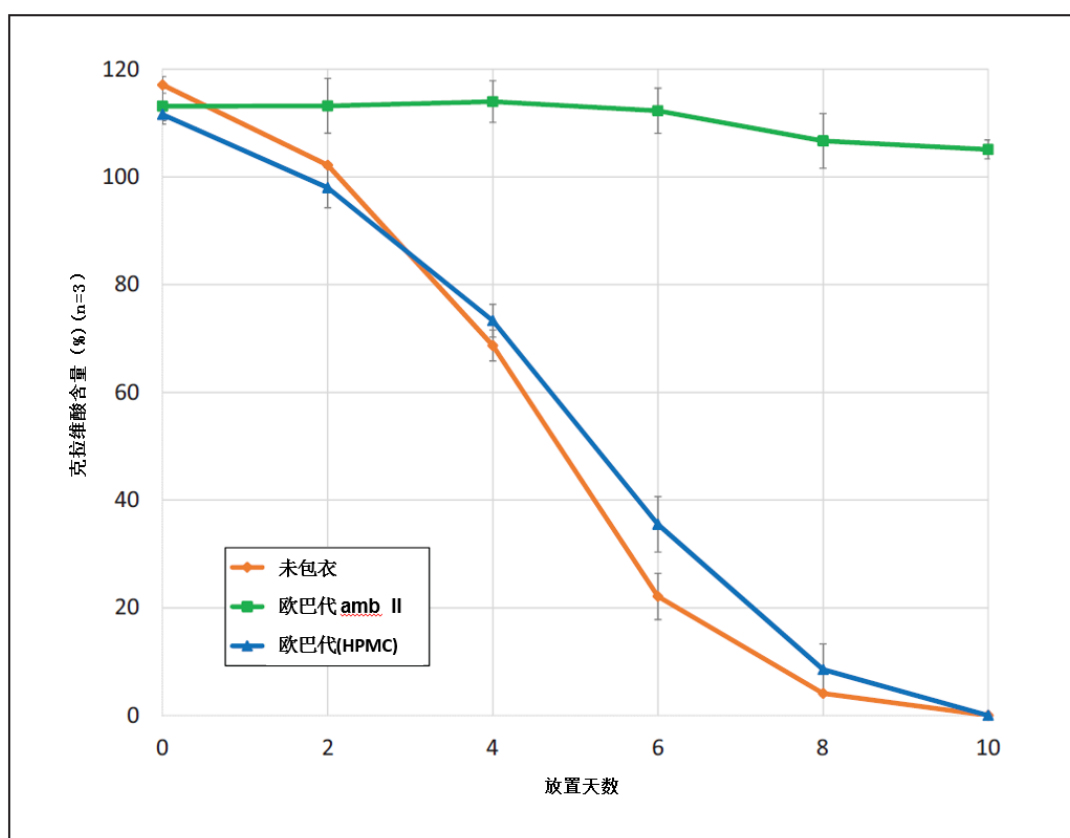
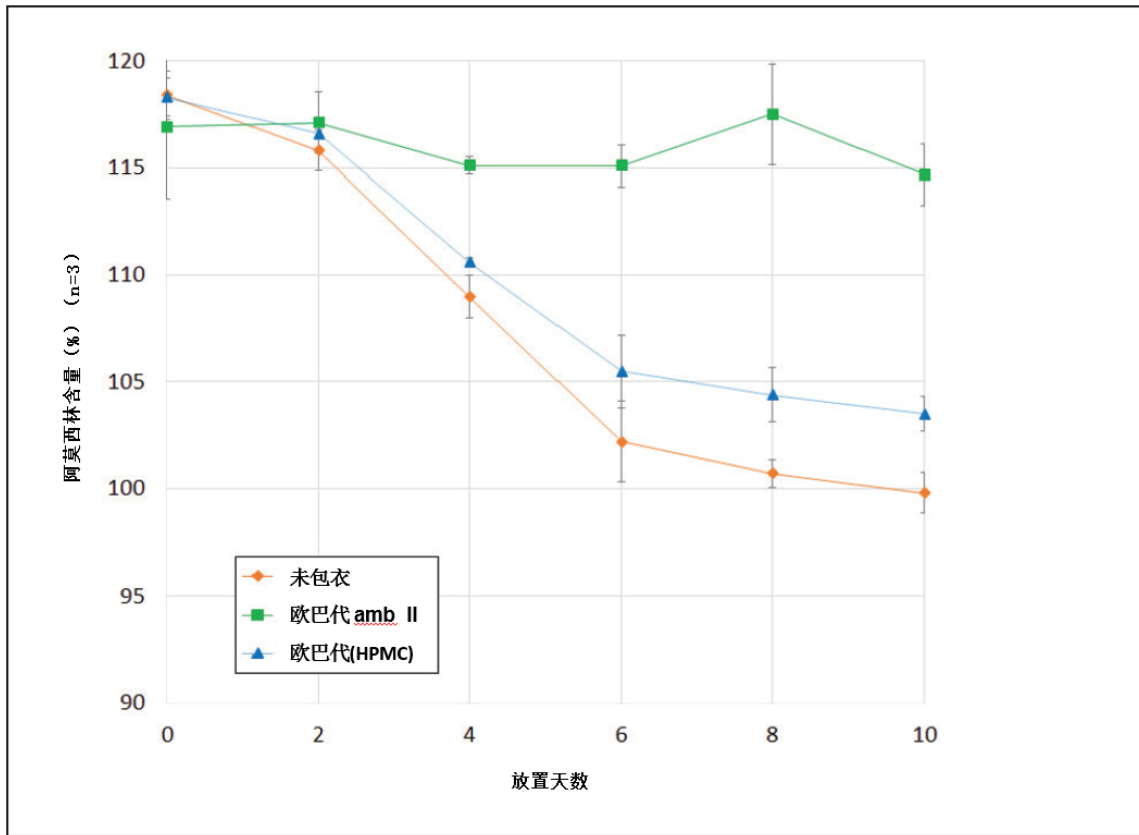


图 4. 阿莫西林含量(%)随放置时间(天)的变化



## 结论

多种类型的包装容器(药瓶、PVC/Aclar/Aclar/铝箔泡罩等)均可以在不同程度上保护湿度敏感型 API，但前提是在未开封的条件下。本研究以短期内暴露于环境中克拉维酸的含量变化为例，阐明了除去药品内包装对其稳定性的不利影响。应用欧巴代 amb II 包衣，即使除去药品内包装，依然可以保障片剂的稳定性。

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:+86-21-61982300/4001009611·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, 2016. 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

pr\_aaps\_in\_use\_stab\_opambII\_11\_2016\_CHN