

热熔挤出法制备尼美舒利固体分散体

赵优曼, 赵会英, 马驰

北京化工大学生命科学与技术学院, 北京 100029

ZHAO You-man, ZHAO Hui -ying, MA Chi

- 摘要
- 参考文献
- 相关文章

Download: PDF (0KB) HTML (1KB) Export: BibTeX or EndNote (RIS) Supporting Info

摘要 目的 采用热熔挤出技术制备难溶性药物尼美舒利固体分散体, 提高其溶出速率。方法 以共聚维酮(PVP-VA64, Kollidon VA64)、聚维酮(PVPK30)或聚乙烯醇-聚乙二醇(3:1)接枝共聚物(Kollicoat IR)为亲水性载体材料, 使用双螺杆热熔挤出机制备尼美舒利固体分散体, 通过差示扫描量热法(DSC)、X射线衍射法(XRD)、傅立叶红外光谱(FTIR)和体外溶出度测定来表征和评价所制备的固体分散体。结果 以共聚维酮为载体制备的尼美舒利固体分散体药物溶出最快, 在pH 7.4的磷酸盐缓冲液中10 min溶出达到81%, 远快于物理混合物(1 h时只有37%)。X射线衍射图谱显示药物晶体衍射峰消失, 差示扫描量热图谱显示药物晶体吸热峰消失, 提示药物是以无定形态分散在载体材料中。结论 热熔挤出加工技术适用于制备尼美舒利-共聚维酮固体分散体, 药物是以无定形态分散在载体中, 溶出度得到显著提高。

关键词: 热熔挤出技术 固体分散体 尼美舒利 共聚维酮 溶出度

Abstract: OBJECTIVE To improve the *in vitro* dissolution of nimesulide by preparing nimesulide solid dispersion with hot melt extrusion (HME) technology. METHODS Using PVP-VA64, PVP K30 or PVA-PEG (Kollicoat IR) as hydrophilic carrier, nimesulide solid dispersion was prepared by hot melt extrusion and characterized by drug dissolution, DSC, XRD and FTIR. RESULTS Nimesulide exhibited rapid *in vitro* dissolution from the solid dispersion using PVP-VA64 as carrier. The cumulative release rate was 81% in 10 min, much faster than its physical mixture (only 37% in 1 h). The results of DSC and FTIR showed that nimesulide was amorphously dispersed in the carrier. CONCLUSION Hot melt extrusion technology is suitable for preparing nimesulide-PVP-VA64 solid dispersion, which can significantly increase drug dissolution.

Keywords: hot melt extrusion, solid dispersion, nimesulide, PVP-VA64, dissolution

收稿日期: 2013-02-04;

基金资助: 基金项目北京市自然科学基金资助项目(7092052)

通讯作者 赵会英 Email: hyzhao@mail.buct.edu.cn

作者简介: 赵优曼, 女, 硕士研究生 研究方向: 速释与控缓释制剂 通讯作者: 赵会英, 女, 博士, 副教授 研究方向: 速释与控缓释制剂、经皮给药 Tel: (010) 64421335, Fax: (010) 64416428 E-mail: hyzhao@mail.buct.edu.cn

引用本文:

赵优曼, 赵会英, 马驰. 热熔挤出法制备尼美舒利固体分散体[J] 中国药学杂志, 2013, 48(3): 185-188

ZHAO You-Man, ZHAO Hui-Ying, MA Chi. Preparation of Nimesulide Solid Dispersion by Hot Melt Extrusion Technology[J] Chinese Pharmaceutical Journal, 2013, 48(3): 185-188

[1] LIU Y. Nimesulide. *Prog Pharm Sci*(药学进展), 1989, 13(3): 40.

[2] LIU B, CAI Y C, WANG P. Preparation of nimesulide solid dispersion and their quality control. *Chin Hosp Pharm J* (中国医院药学杂志), 1999, 19(8): 497-498.










[3] WANG S H, WANG R X, ZHU L Y. Preparation of β -cyclodextrin complexation of nimesulide. *Chin J Coal Ind Med* (中国煤炭工业医学杂志), 2008, 11(12): 1911-1912.

Service

- ▶ 把本文推荐给朋友
- ▶ 加入我的书架
- ▶ 加入引用管理器
- ▶ Email Alert
- ▶ RSS

作者相关文章

- ▶ 赵优曼
- ▶ 赵会英
- ▶ 马驰

- [4] MONEGHINI M, ZINGONE G, ZORDI N D. Influence of the microwave technology on the physical-chemical properties of solid dispersion with nimesulide. *Powder Technol*, 2009, 195 (3) : 259-263. 
- [5] BREITENBACH J. Melt extrusion: From process to drug delivery technology. *Eur J Pharm Biopharm*, 2002, 54(2): 107-117. 
- [6] VERRECK G, SIX K, MOOTER G V, et al. Characterization of solid dispersions of itraconazole and hydroxypmpylmethylcellulose prepared by melt extrusion-part I. *Int J Pharm*, 2003, 251(1/2) : 165-174. 
- [7] WANG L, CUI F D, HAYASE T, et al. Preparation and evaluation of solid dispersion for nitrendipine-carbopol and nitrendipine-HPMCP systems using a twin screw extruder. *Chem Pharm Bull*, 2005, 53(10): 1240-1245. 
- [8] YANG R, TANG X, HUANG H F. A preliminary evaluation of hot melt extrusion technology on improvement of silimarin dissolution. *Chin J New Drugs* (中国新药杂志), 2005, 14(11): 1305-1308.
- [9] FORSTER A, HEMPENSTALL J, RADES T. Characterization of glass solutions of poorly water-soluble drugs produced by melt extrusion with hydrophilic amorphous polymers. *J Pharm Pharmacol*, 2001, 53(3): 303-315. 
- [10] GREENHALGH D J, WILLIAMSC A C, TIMMINS P, et al. Solubility parameters as predictors of miscibility in solid dispersions. *J Pharm Sci*, 1999, 88(11): 1182-1190. 
- [11] GHEBREMESKEL A N, VEMAVARAPU C, LODAYA M. Use of surfactants as plasticizers in preparing solid dispersions of poorly soluble API: Selection of polymer-surfactant combinations using solubility parameters and testing the processability. *Int J Pharm*, 2007, 328 (2) : 119-129. 
- [12] GUPTA J, NUNES C, VYAS S, et al. Prediction of solubility parameters and miscibility of pharmaceutical compounds by molecular dynamics simulations. *Phys Chem B*, 2011, 115 (9) : 2014-2023. 
- [13] BERGESE P, BONTEMPI E, DEPERO L E, et al. Microstructural investigation of nimesulide-crospovidone composites by X-ray diffraction and thermal analysis. *Composit Sci Technol*, 2003, 63 (8) : 1197-1201. 
- [1] 单利, 史焱, 王玉丽, 赵琳琳, 杨美燕, 蒋庆宇, 高春生. 基于流化床包衣工艺的伊曲康唑速释微丸的制备和评价研究[J]. 中国药学杂志, 2013,48(1): 54-58
- [2] 张焯 杜祯 孙少平 黎畅明 唐海谊 郑颖. 喷雾冷冻干燥法制备丹参酮 II A 固体分散体及其理化性质评价[J]. 中国药学杂志, 2012,47(3): 204-
- [3] 田霞 全东琴. 联苯双酯过饱和和自微乳释药系统的体内外评价[J]. 中国药学杂志, 2011,46(8): 600-604
- [4] 廖正根 张晓辉 赵国巍 杨玉芬 梁新丽 杨连威 杨明 盖国胜. 不同粒度红花粉体理化性质的比较研究[J]. 中国药学杂志, 2010,45(8): 602-606
- [5] 陈鹰 杜蓉 曾晓枫 史琼枝 刘宏. 促过饱和物质对多西他赛自乳化系统体外释药特性的影响[J]. 中国药学杂志, 2010,45(6): 444-449
- [6] 郭涛 孙方迪 潘卫三 孙学惠 高声传 侯悦. 紫杉醇包合物的制备与鉴定[J]. 中国药学杂志, 2010,45(4): 283-286
- [7] 陈如萍 张红 张昕 王燕玲 刘阳. 尼美舒利对乳腺癌细胞放射增敏作用的研究[J]. 中国药学杂志, 2010,45(22): 1724-1728
- [8] 姜雄平 ;傅小英 ;魏立平 ;靳守东 . 溶出度检查计量判断方案的建立暨与计数方案的比较[J]. 中国药学杂志, 2009,44(23): 1825-1829
- [9] 耿东升 ;傅小英 ;陈明 . 光纤溶出度仪测定复方磺胺甲 唑片溶出度的研究[J]. 中国药学杂志, 2009,44(17): 1343-1345
- [10] 宋笑丹;唐景玲;邸哲婷;魏华;吴琳华. 伊曲康唑自乳化释药系统的制备及溶出度研究[J]. 中国药学杂志, 2009,44(11): 846-848
- [11] 倪静;朱铤. 虾青素自乳化软胶囊的研究[J]. 中国药学杂志, 2009,44(11): 849-852
- [12] 杜祯;郑颖;黎畅明;王一涛;唐海谊. 喷雾冷冻干燥技术进展及其在药剂学中的应用[J]. 中国药学杂志, 2009,44(10): 724-727
- [13] 韩刚;翟丽;赵琳琳;刘莉;林庆辉;毕瑞. 姜黄素固体分散体在大鼠体内的药动学研究[J]. 中国药学杂志, 2009,44(09): 698-700
- [14] 陈鹰;郑庆玲;刘宏;辛华雯. 伊曲康唑自乳化释药系统的处方研究[J]. 中国药学杂志, 2008,43(22): 1714-1718
- [15] 田娟;冉黎灵;周彦彬;丁劲松. 蛋白沉淀结合 HPLC 测定人血浆中尼美舒利及相对生物利用度[J]. 中国药学杂志, 2008,43(14): 1100-1102