

微囊剂：新药开发推动力 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/470/2021_2022__E5_BE_AE_E5_9B_8A_E5_89_82_EF_c67_470639.htm 微囊剂是近20多年兴起的技术，在国外已得到了广泛的应用。除了香料、化妆品、纺织等产业，微囊剂也在药品、保健品上被广泛使用，比如用于加工口腔速崩剂和易氧化、易分解、口味不佳的药物。扩展油类原料的应用众所周知，-胡萝卜素、维生素A、维生素E、鱼油、月见草油、葡萄子油、苏子油等油类物质难以利用常规工艺加工成固体剂，而利用微囊剂可将油类加工成固体剂，从而进一步加工成片剂、胶囊剂甚至粉状物等固体产品。药物学家指出，-3脂肪酸、月见草油、苏子油等原料对氧气十分敏感，在加工成微囊剂以后，由于膜材料可以隔绝氧气进入膜内，从而防止产品氧化失效，产品的保质期得到了较大的延长。如芬兰在几年前开发出了新型“鱼油粉”饮料。“鱼油粉”实际上是一种直径仅几微米的微囊鱼油，用肉眼观察是一种淡黄色粉末，有良好水溶性，且无鱼油腥味，因此颇受欧美消费者欢迎。另外，利用微囊剂技术还可将其它各种保健油类原料加工成无味粉状物并加入到牛奶、咖啡、等食品里，从而大大扩展了鱼油等油类保健品的应用范围。囊壳材料日新月异进入21世纪，药物、保健品或其它原料的微囊化加工技术又有重大新进展。随着材料工艺学日新月异的发展，一些价廉物美的新材料被陆续开发成为适合加工成微囊外壳的新原料，微囊剂的生产成本开始大幅下降。按其性质的不同，国外已开发使用的囊壳材料主要有以下6类：1、多糖/水凝胶类物质，如淀粉、褐藻胶、琼脂、

果胶、卡拉胶（角叉菜胶）及其它胶类。2、蛋白质及白蛋白，如明胶、酪胺、玉米蛋白、大豆蛋白与白蛋白等。3、脂肪与脂肪酸类，如甘油单酯、甘油双酯和甘油三酯、月桂酸、辛酸、棕榈酸、硬脂酸及其盐。4、纤维素酯类，如甲基纤维素、乙基纤维素、CMC、HPMC等等。5、亲水性与亲油性蜡，如虫胶、蜂蜡、巴西棕榈蜡和大分子聚乙二醇（也是一种蜡状物）等等。6、蔗糖衍生物，如蔗糖脂肪酸酯等，类物质具有良好的水溶性以及很好的成膜坚牢度，故非常适合鱼油、月见草油和VE、VA及其它油状原料加工成微囊剂。消费者（尤其儿童）非常喜欢用蔗糖脂肪酸酯加工的微囊剂的口感（因其略带甜香味）。

技术深化 传统的微囊加工技术采用水法加工，即利用双喷嘴将喷出液滴状微囊经自由落体落入事先装有冷却水的盛盘里。柔软的热微囊在冷却水中迅速冷却，由于水的张力作用而自动成为圆珠状囊体，最后经干燥即成为成品。这一技术目前在世界各地的不少企业仍在使用中。因其工艺简单，无需复杂的干燥设备，故非常适合中小型制药公司采用。由于微囊剂的应用范围逐渐扩大，所以对其技术的开发也随之不断加深，比如将微囊剂加工成直径仅1微米左右的超微微囊，可用于进一步开发成口腔快溶片、速崩片或肠溶片等全新剂型，这为新药的顺利开发奠定了坚实的基础。近来，一种在20世纪60年代由意大利Sananomin公司首先开发成功的微囊生产技术重新引起西方制剂业界的兴趣，并对其进行了技术改进。意大利人发明的微囊生产技术大体为：先将药物原料与一定量液体（通常为水）一起经充分搅拌、混合成为粘度较高的半固体“膏状物”，然后经一只喷嘴挤出成长条状，在挤出喷嘴瞬间自动包

上一层由纤维素酯材料组成的“外皮”，最后经切割刀将其切成圆柱型小粒“微囊”。由于受设备的限制，利用该技术加工的微囊直径较大（一般在100微米~6毫米之间）。但西方药剂研究人员认为，这一微囊加工老工艺也有其优点：首先，无需复杂的加工设备（仅需一台挤出机即可），只要对喷嘴的口径和原料挤出压力加以调整就能进一步加工成直径小的微囊剂；其次，不用任何有机溶剂，故对环境无影响。估计该工艺即使在半世纪后仍有其可行性。近年来，国外又开发出一种“旋转圆盘法”微囊加工新技术。其原理是这样的：先将原料药与有机溶剂一起经搅拌后成为混悬物液体，在特制高速旋转圆盘上，药物混悬物与膜剂接触后包膜成功，最后经喷雾干燥除掉其中溶剂而成为微囊产品。旋转圆盘法的优点是，可将尽可能多的药物原料全部纳入微囊囊体中，且微囊破碎率较低，故对加工复方药物制剂尤为适宜（如我国的不少中成药均为复方制剂，有时一只产品所用原料多达一二十种，这样的中成药产品非常适合使用旋转圆盘法加工成微囊剂）。据国外厂商介绍，旋转圆盘法适用于加工各种药物原料如油状液体、高粘度药物以及由不同性质的原料组成的混合物等的微囊剂。综上所述，微囊剂加工技术在药品、保健品生产或其它各行各业中有着巨大发展空间，某些原料在加工成微囊剂后可大大提高其实用性。在可以预见的将来，微囊剂将成为国际医药市场上最常见的产品之一，其市场前景极其光明。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com