

一、透皮给药系统

透皮给药系统(transdermal drug delivery system TDDS) 是指在皮肤表面给药，使药物以恒定速度(或接近恒定速度)通过皮肤各层，进入体循环产生全身或局部治疗作用的新剂型。与传统的给药方式相比，透皮贴剂有以下优点：

- 1) 可产生持久、恒定和可控的血药浓度，从而减轻不良反应。
- 2) 可避免肝脏的首过效应，提高药物的生物利用度。
- 3) 减轻注射用药的痛苦。患者可自己用药，出现问题可及时停药，使用方便。
- 4) 减少给药次数和剂量。

最近透皮给药系统成为国内外制药研发企业的研究热点。而透皮给药系统的重要的质量评价包含体外释放（*vitro release testing*）和 体外渗透（*in vitro permeation testing*）。

本文将分享使用 LOGAN SYSTEM 918-12 干加热自动透皮系统对日本兴和株式会社生产的吲哚美辛贴剂的体外释放研究。



LOGAN SYSTEM 918-12 具有以下特点：

- 具有自动排气泡功能，有效避免气泡对实验影响
- 自动取样系统，提高试验效率
- 高精度注射泵，实现准确快速取样
- 采用干加热方式，加热效率高
- 独特的扩散池设计，便于清洗、降低扩散池破碎风险
- 实时监测接受池溶媒温度
- 同时进行 12 个样品的渗透测试
- 保护盖具有保温和避光作用
- 不同尺寸硅胶垫片可控制给药剂量



●数据审计追踪功能，三级权限管理，符合 FDA 21 CFR Part 11 要求

二、耗材与设备

2.1 耗材：

硝酸纤维素、Strat-M 膜、吲哚美辛贴剂（兴和株式会社）、磷酸二氢钠、磷酸、氢氧化钠、乙腈、乙醇

2.2 设备：

透皮仪（LOGAN），液相

三、试验方法及色谱条件

3.1 试验方法：

接受液：10%乙醇 pH7.4 溶液

取样时间：2,4,6,8,12,16,24 小时

扩散池体积：12mL

取样体积：6mL

温度：32°C

模式：排空模式

转速：600rpm

3.2 色谱条件：

色谱柱：C18 (WondaSil C18-WR 5 μ m 4.6X150mm)

流动相 A (0.1mol/L 冰醋酸溶液) : 流动相 B (乙腈) =60:40

柱温：40°C

流速：1ml/min

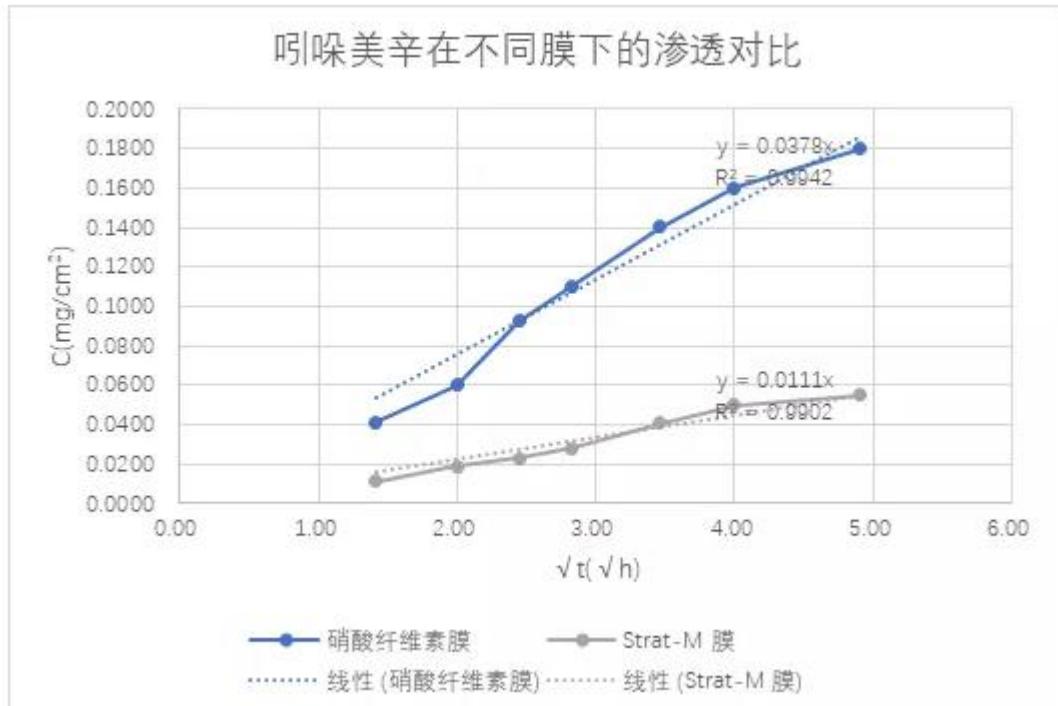
进样量：20 μ l

检测波长：228nm

四、结果与讨论

4.1 结果

以时间的开根号为横坐标，单位面积下的累计渗透量为纵坐标绘制曲线。



4.2 讨论

从膜的结构上对比硝酸纤维素膜较 Strat-M 薄，因此推测使用硝酸纤维素膜时渗透率会偏大。图显示硝酸纤维素膜的透过性较大、渗透率约为 Strat-M 膜的三分之一。虽然纤维素膜的通透性较大，但在药物的研发过程中因其廉价及适用范围较广，有利于各种 TDDS 处方和工艺的开发。