



NIKYANG | SOTAX

溶出度/ 释放度测试 技术服务



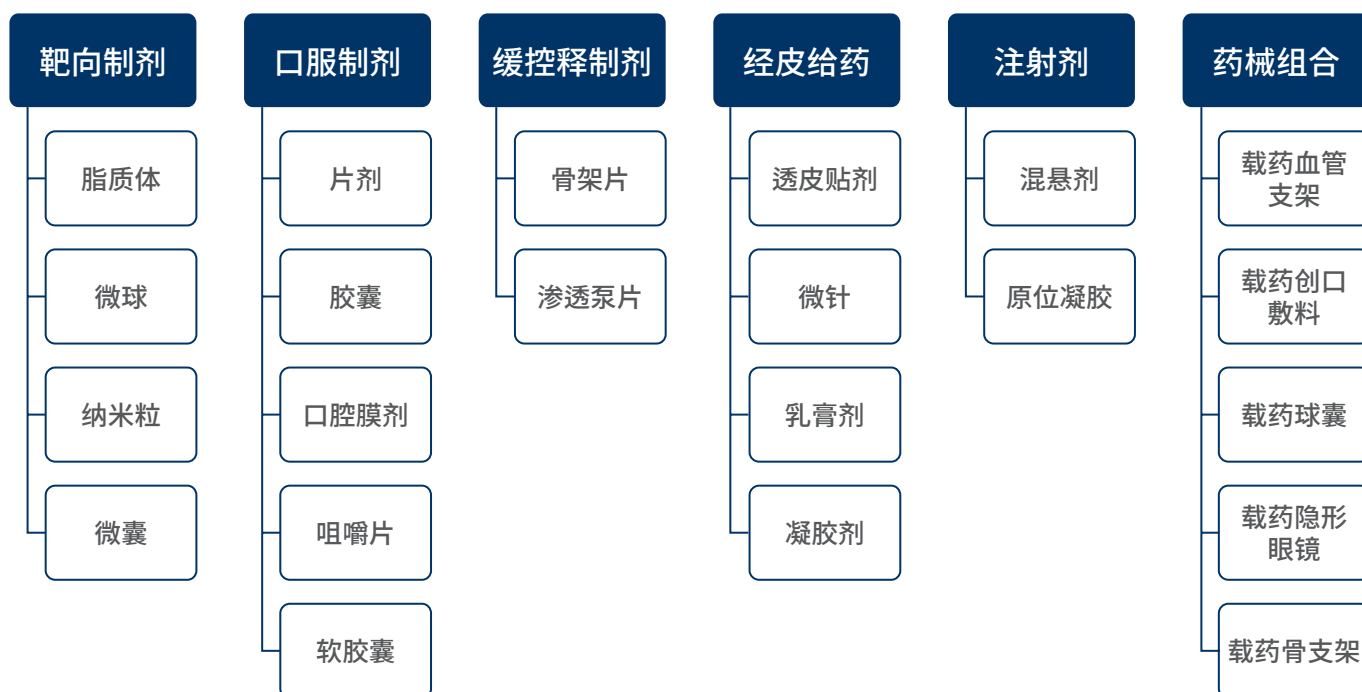
80% 案例有效判别 BE 失败批次的体外溶出差异



我们的溶出度/ 释放度测试技术服务

传统以来，口服制剂由于其制剂工艺相对简单，机理研究相对透彻，病人顺应性好等特点，通常是药物研发者的首选剂型。但是，随着药物分子的进一步开发，难溶性分子的占比越来越大，使得制剂形态呈现多样化转变，多种制剂类型呈增长趋势。另外，为改善肽类和蛋白类生物大分子化合物的生物利用度，又进一步促发新型给药制剂的发展，因而，研究人员未来面对的将是剂型多样化的挑战。我们力扬研发团队，专注于与溶出相关的理论与实践研究，在溶出领域深耕多年，累积了丰富的实战经验，轻松应对溶出相关的各种挑战。我们具有最前沿的专业知识、研究人员及设备，至今累计已经完成超过 70 个案例，当中 80% 案例有效判别 BE 失败批次的体外溶出差异，提高 BE 成功率，节省研发成本及时间。

我们探索药物剂型的足迹



我们深究过的典型样品



利培酮
醋酸亮丙瑞林
纳曲酮



两性霉素B
多柔比星



奥氮平
阿扎胞苷
曲安奈德



Omega 3 酸乙酯
骨化三醇
黄体酮



阿伐他汀钙片
双氯芬酸钠缓释片
泊沙康唑
奥卡西平片
拉唑类肠溶片/ 微丸
硝味太尔片



磷酸奥司他韦

您的烦恼...

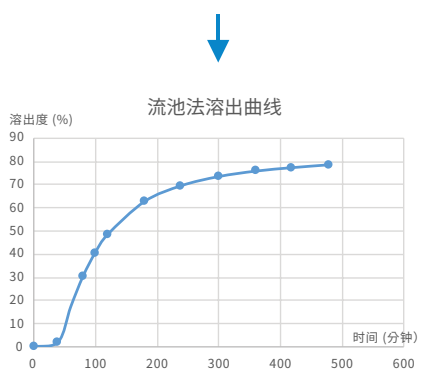
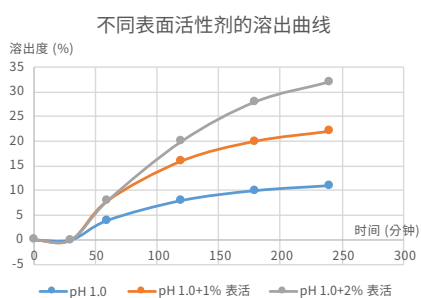
制剂太难溶出？

亲脂性制剂
API 极其难溶、重现性
差、RSD 大？

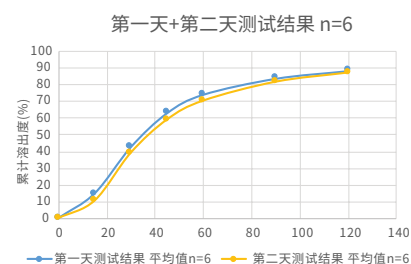
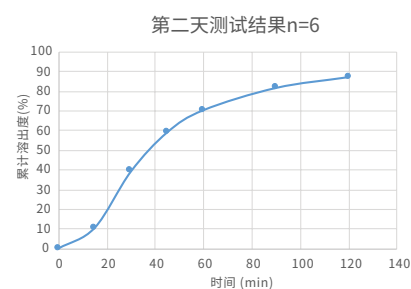
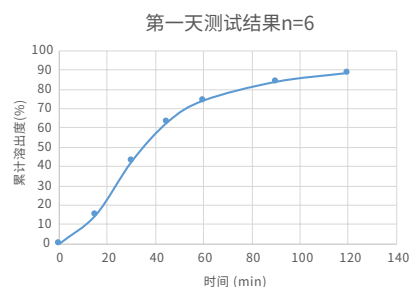
我们可以解决

优选溶出测试手段，解决难溶药物的溶出度问题

优化方法前，溶出量小于40%；优化方法后，相同时间内，即使减少表面活性剂用量，溶出量大于75%。



优化溶出测试方案，软胶囊溶出测试难题迎刃而解



您的烦恼...

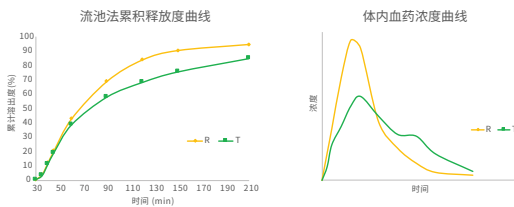
仿制药 BE 不易
过关？

缓释纳米晶溶出
太快？

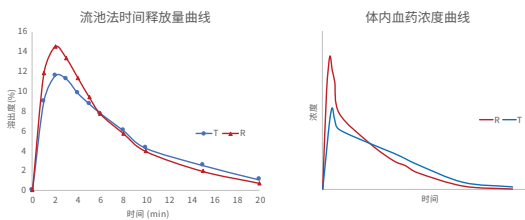
我们可以解决

快速优化测试条件，寻找 体外溶出特征曲线

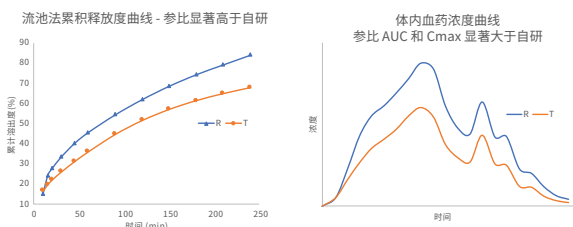
BCSII 类药，原有体外几十条溶出曲线均未判别 BE 失败处方，优化方法后，差别显而易见。



BCSIII 类药，所有介质5min 快速溶出，无法筛选方；
优化方法后，体外差异一目了然。

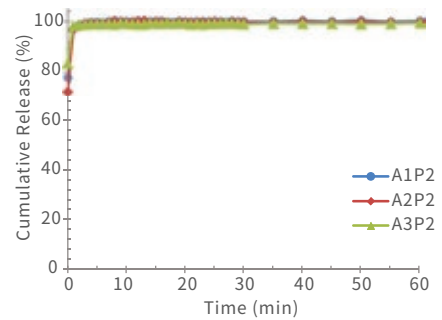


BCSIV 类药，原有体外判别方法体内与体外趋势相
反；优化方法后，体外体内方法正相关。

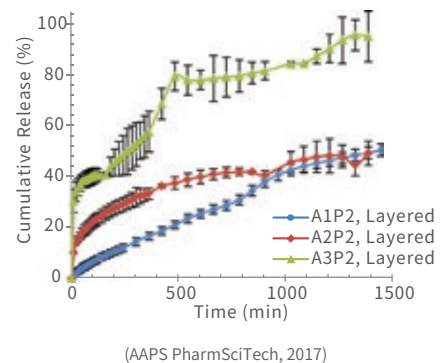


优化溶出测试方案，有效 区分处方和工艺

桨法50rpm，5min 所有处方工艺产品100%溶出。



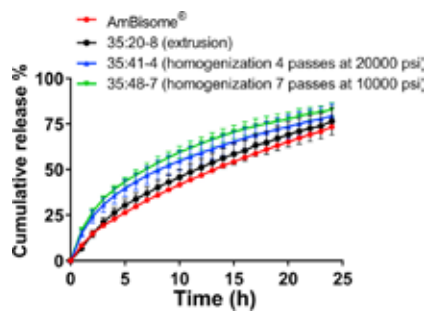
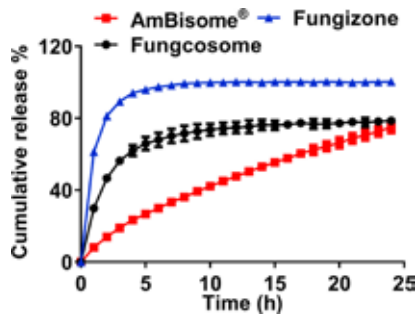
优化方法后，凸显处方工艺差异。



(AAPS PharmSciTech, 2017)

脂质体如何检测释放度？

透析+流池法，脂质体工艺和处方筛选的得力助手试法

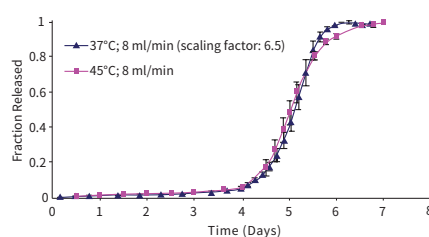
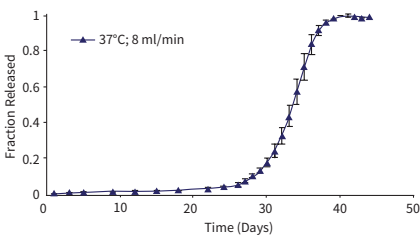


(European J. of Pharmaceutics and Biopharmaceutics, 2019)

市场不同类型两性霉素 B 产品 (脂质体、胶束、胶束 + 脂质体混合物) 有效区分割析不同工艺脂质体，有利于仿制产品开发。

加速实验——微球释放的核心

加速测试，一举克服微球等长效制剂体外释放周期长的问题

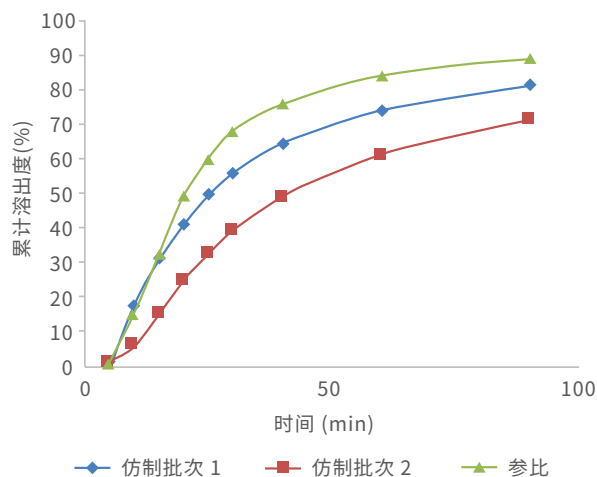


(International J. of Pharmaceutics, 2011)

45°C 升温测试，完美拟合 37°C 条件下的释放曲线，并大大缩短测试周期，加速研发和质控进程。

如何解决 Omega-3 酸乙酯软胶囊溶出的难题？

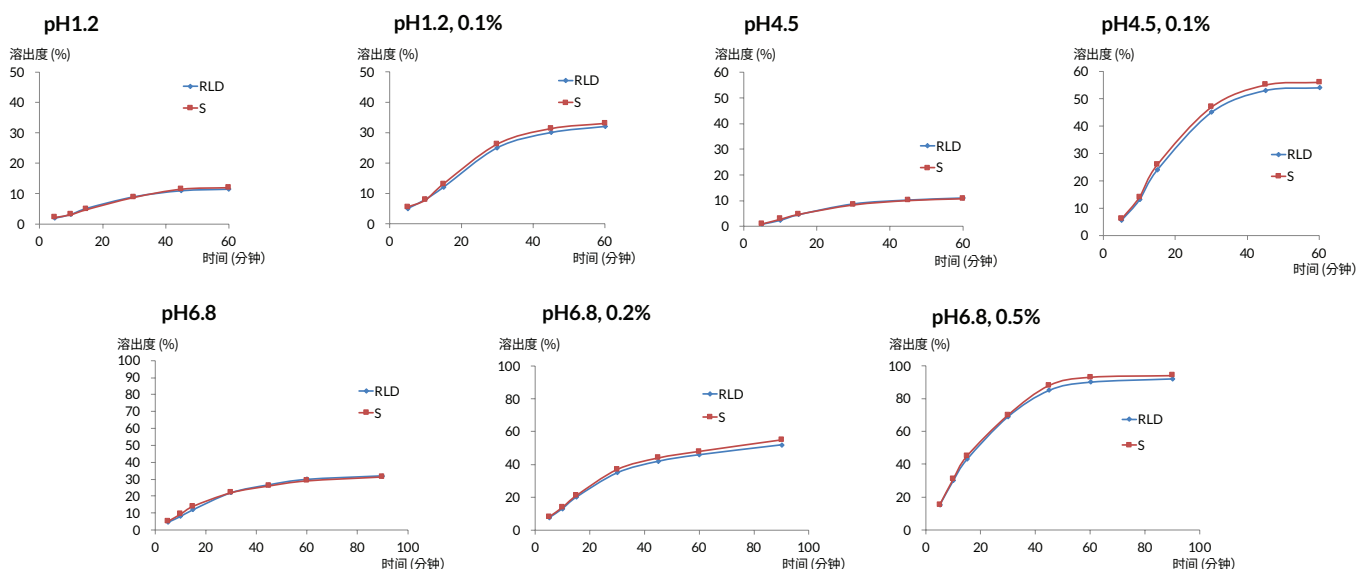
FDA 推荐 Omega-3 酸乙酯软胶囊溶出测试法



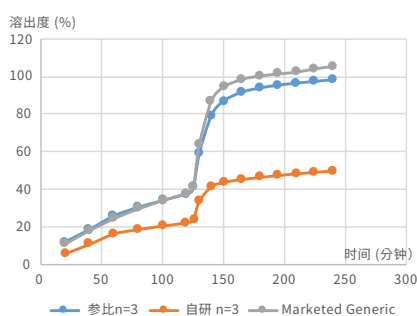
油性内容物的难点在于：一) 油相很难在水相溶出；二) 油相漂浮分散在水相顶端的特性，让取样分析变得困难；三) 溶出中搅拌动力的影响因素众多，需要优化测试结果的 RSD，以满足法规的要求。因而，选择合适的溶出方法和溶出设备，成为该类样品测试的关键所在。FDA 根据已有经验为从事软胶囊工作的研究者特别推荐了流池法，已解决上述测试中的问题。

如何节省成本，避免不必要的 BE？

应用流池法放大自研处方和参比制剂的差异，预先发现问题



浆法多条溶出曲线对比自研产品与参比制剂显示无差异，然而 BE 失败。



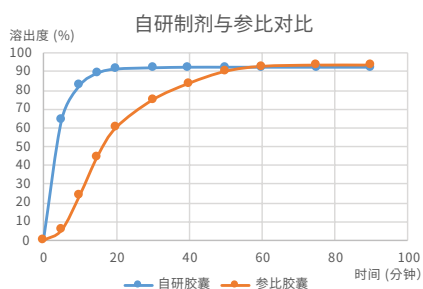
流池法

使用流池法放大自研处方和参比制剂的差异，成功找出 BE 失败的原因。应用在 BE 前，可预先发现问题，避免不必要的 BE。

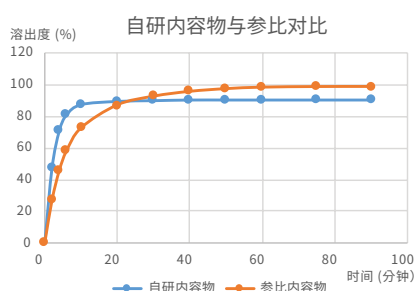
如何找出胶囊仿制产品的差异来源？

以流池法配合各种流通池，分阶段对胶囊、内容物及 API 进行检测

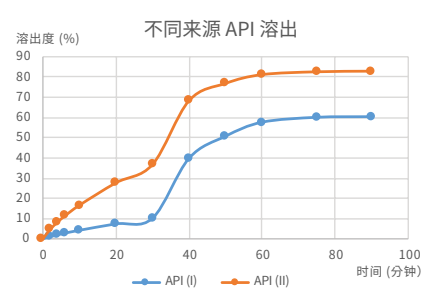
胶囊



粉末内容物



API



以流池法配合各种流通池，分阶段对胶囊、内容物及 API 进行检测，找出差异来源。流池法配备的流通池可应用于速释胶囊/片剂，缓控释胶囊/片剂，复杂注射剂—混悬剂、微球、脂质体、纳米晶、微丸片/胶囊、软胶囊、栓剂、颗粒剂、粉末API，应用领域广阔。



我们的优势

业界最为专业的研究人员

力扬在广州和香港设立了 2 个专业的溶出度测试实验室，传承瑞士 SOTAX 公司 40 余年的溶出经验，研发团队至今完成超过 70 余个溶出测试项目，涉及多种制剂形态。

顶级设备与专业认证

配备瑞士 SOTAX 公司的桨法、篮法、流通池法、转筒法和桨碟法溶出设备，提供稳定、可靠、合规的数据支持。同时我们拥有国际认证的工程师资格，提供溶出设备 IQ、OQ 和 PQ 认证服务。

多剂型溶出项目经验

涉及速释胶囊/片剂，缓控释胶囊/片剂，复杂注射剂—混悬剂、微球、脂质体、纳米晶、微丸片/胶囊、软胶囊、栓剂、颗粒剂、粉末 API。

强大的国际后援团队

力扬与法国 SPS 药物服务公司达成战略合作，共同开拓溶出度测试服务市场。SPS 是世界首家专注溶出度测试的合同服务组织，接受世界范围内的合同订数以百计，经验丰富。

药物研发的强大网络

深耕制药行业多年，我们深知药物研发过程的各个痛点，同时累积建立了强大的网络资源，从化学合成、制剂研发，到生物研究，都可以为你联系相关的专业合作伙伴。