

Analysis of excipient effects at the oil/water interface for a rational formulation development

Bachler Simon

Life Science Technologies, Pharmatechnologie

Hochschule für Life Sciences FHNW, Institut für Pharma Technology, 4132 Muttenz

KURZZUSAMMENFASSUNG

In einer Screening Phase wurde ein neues Co-Tensid Gensurf α -142 und ein neues Tensid Gensurf α -142 25EO gefunden. Diese wurden durch statistische Versuchsplanung genauer charakterisiert, dabei wurde eindeutig ein Synergismus festgestellt. In Partikelgrößenuntersuchungen wurde bei verschiedenen Konzentrationen eine minimale Teilchengröße ermittelt. Die gefundenen starken Grenzflächenspannungserniedrigungen konnten jedoch nicht direkt auf ein selbst-emulgierendes System übertragen werden, diese scheinen viel mehr von flüssigkristallinen Zuständen abzuhängen.

EINLEITUNG

Das Ziel dieser Bachelor-Thesis war, die Effekte von Hilfsstoffen in einer Öl/Wasser-Grenzfläche im Hinblick auf eine rationale Arzneimittelformulierungsentwicklung zu analysieren. In einer Screening Phase wurden verschiedene Substanzen mit Polysorbat 80 (PS80) und Cremophor EL (CrEL) in Miglyol 812 und Wasser in einem Spinning Drop Tensiometer analysiert, um die Grenzflächenspannungserniedrigung aufzuzeigen.

Nachfolgend wurden mit einer statistischen Versuchsplanung zwei Gemini-Tenside genauer untersucht. Toxikologische Daten für das Gemini-Tensid Gensurf α -142 sind vorhanden, welche die Substanz für eine pharmazeut. Anwendung sehr interessant machen. Die gefundenen Effekte wurden versucht auf ein selbst-emulgierendes System zu übertragen. Für diese Untersuchungen wurde mit einem Zetasizer ZS die Teilchengröße als z-Average und der Polydispersitätsindex ohne Ultraschallbehandlung (US) sowie als Referenz mit US gemessen.

RESULTATE

Die gefundenen Interaktionen zwischen den Molekülen sind in den nachfolgenden Antwortflächen des stat. Versuchsp. dargestellt.

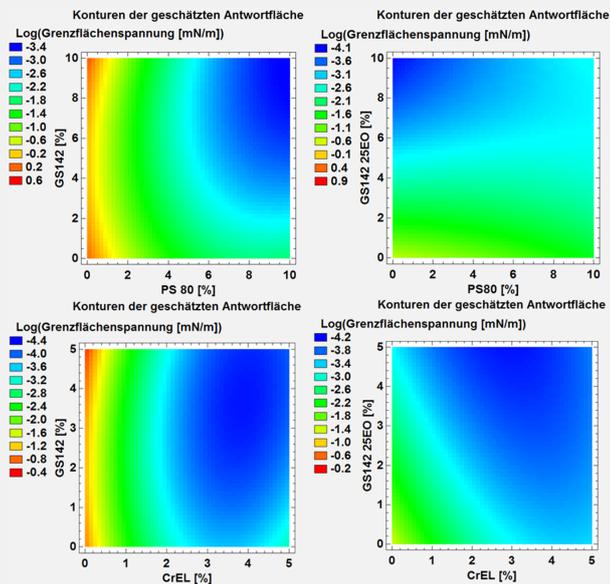


Abb. 1: Statistischer Versuchsplan: Antwortflächen der Tensidkombinationen

Ein neues Co-Tensid wurde mit Gensurf α -142 (GS142) gefunden. Zusätzlich wurde mit Gensurf α -142 25EO (Ethoxyliert) ein neues sehr starkes Tensid identifiziert. Bezüglich der Untersuchungen für die Selbst-Emulgierung wurde in den verwendeten Modellen zum Teil ein Minimum der Teilchengröße ohne US gefunden. In diesem erfolgte die Selbst-Emulgierung mit einer „gentle agitation“. Mit US wurden generell niedrigere Teilchengrößen als ohne US gemessen.

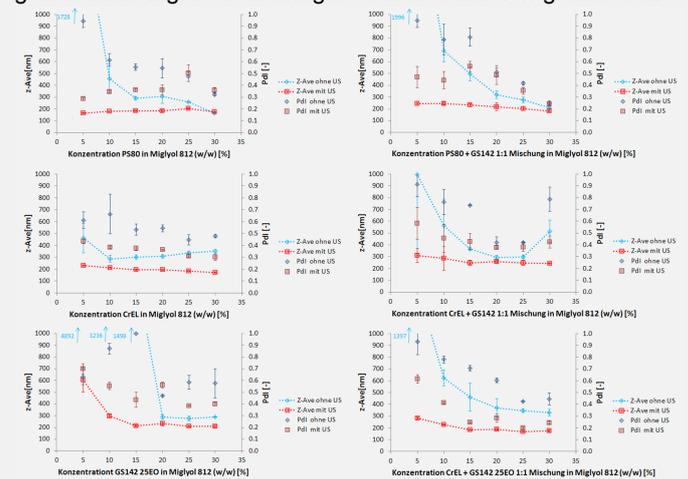


Abb. 2: Teilchengrößen (z-Ave) und Polydispersitätsindexe (PDI): 1:100 in H₂O

SCHLUSSFOLGERUNG

Das Co-Tensid GS142 zeigt einen Synergismus mit CrEL und PS80. GS142 25EO wirkt alleine als starkes Tensid und mit CrEL existiert ebenfalls ein Synergismus. Eine niedrige Grenz-

flächenspannung lässt sich jedoch nicht direkt auf ein selbst-emulgierendes System übertragen. Die Selbst-Emulgierung scheint viel mehr von flüssigkristallinen Zuständen abzuhängen, weil beim Verdünnen mit Wasser verschiedene Zustände gemäss dem Dreiphasendiagramm durchlaufen werden.

REFERENZEN

Paradkar, et al., J. Pharm. Pharmaceut. Sci. 12, 2009.
Rosen et al., Surfactants and interfacial phenomena, 2012.

Begleitdozent: Prof. Dr. Martin Kuentz
Experte: Dr. Georg Sydow
Betreuerin: Zdravka Misic