



Doctoral Thesis

Ueber die Eignung von Fettpellets als perorale Depotarzneiform

Author(s):

Bergauer, Reinhardt

Publication Date:

1976

Permanent Link:

<https://doi.org/10.3929/ethz-a-000093154> →

Rights / License:

[In Copyright - Non-Commercial Use Permitted](#) →

This page was generated automatically upon download from the [ETH Zurich Research Collection](#). For more information please consult the [Terms of use](#).

ÜBER DIE EIGNUNG VON FETTPELLETS ALS PERORALE DEPOTARZNEIFORM

Abhandlung
zur Erlangung
des Titels eines Doktors der Naturwissenschaften
der
**EIDGENÖSSISCHEN TECHNISCHEN
HOCHSCHULE ZÜRICH**

vorgelegt von
REINHARDT BERGAUER
Apotheker, Universität Erlangen
geboren am 11. Januar 1948
Deutscher Staatsangehöriger

Angenommen auf Antrag von
Prof. Dr. P. Speiser, Referent
Prof. Dr. M. Soliva, Korreferent

aku-Fotodruck
Zürich
1976

ZUSAMMENFASSUNG

In der vorliegenden Arbeit wird die Eignung von Fettpellets als perorale Depotarzneiform untersucht. Der Durchmesser der Pellets liegt zwischen 0,1 und 1,0 mm.

Als Modelle für Fette werden Glycerintrilaurat, Glycerintrimyristat und Glycerintripalmitat verwendet, als Modell für den Wirkstoff dient PAS-Na.

Als Technologie zur Herstellung der Arzneiform wird die Sprüh-
erstarrung benutzt. Für die Ausführung dieser Arbeitsoperation
werden Vorschriften erfaßt.

Die Arzneiform wird physikalisch untersucht. An Hand der Freigabeeigenschaften in vitro wird die Eignung der Pellets als perorale Depotarzneiform beurteilt. Das Fett Glycerintrilaurat setzt sich in der vorliegenden galenischen Form den Wirkstoff zu schnell frei, es liegt keine Freigabeverzögerung vor. Die Fette Glycerintrimyristat und Glycerintripalmitat geben den Wirkstoff successive ab, sodass eine Freigabeverzögerung im Sinne einer Depotarzneiform vorliegt. In vivo Versuche am Menschen zeigen eine Rangkorrelation mit der in vitro Freigabe.

Steuergrößen für die Wirkstofffreigabe im Sinne einer Beeinflussung der Freigabegeschwindigkeit sind:

1. Die Kettenlängen der eingesetzten Fette, somit die Hydrolysierbarkeit der Matrix.
2. Die Oberfläche der Arzneiform; damit lassen sich über verschiedene Pelletgrößen die Freigabegeschwindigkeiten steuern.
3. Die Konzentrationsverhältnisse Wirkstoff / Fett. Mehr Feststoff in den Pellets schwächt die Matrix, sodass Hydrolyse und Wirkstofffreigabe beschleunigt sind.
4. Die Einarbeitung von Stoffen, die die Hydrolyse beeinflussen. Untersucht wird der Einfluss von Calciumchlorid, es zeigt sich eine Verzögerung der Wirkstoff-Freigabe.

Summary

The suitability of fat pellets for oral application was examined in this study.

Glyceroltrilaurate, glyceroltrimyristate, and glyceroltripalmitate were used as model fats. Pas-Na served as model drug.

The technological conditions for the production of the drug preparation were evaluated. The physical properties of this drug preparation were examined. The drug release properties were tested in vivo and in vitro.

The parameters of the rate and the amount of the drug release are

1. the chain length of the fats,
2. the surface of the drug preparation,
3. the concentration ratio of drug to fat,
4. the incorporation of substances, that influence hydrolysis.

Dissertations-Nr.: 5768

Reinhardt Bergauer

Ueber die Eignung von Fettpellets als perorale Depot-
arzneiform

Prof. P. Speiser, Referent

Prof. M. Soliva, Korreferent