

LOGAN Permeafilm 仿生膜系列之 PermeaPad® - 测试药物渗透性

科研人员最新发明的新型仿生膜 PermeaPad®主要用于测试药物的渗透性。

PermeaPad®是一种具有三明治式层状结构的人工纤维素-磷脂仿生膜，用于测试药物的表观渗透系数(Papp)。研究证明，对于无论是高渗透性还是低渗透性化合物，PermeaPad®获得的数据与文献中成熟的体外渗透方法（Caco-2 细胞测定或PAMPA 数据）之间存在良好的线性相关性，研究还证明了 PermeaPad®对亲水性标记物渗透的密封性、对质子渗透的阻力(pH 值变化)和有效期等性能。此外，PermeaPad®在不同 pH 介质和较长时间的研究环境下，能保持较好的完整性和耐表面活性剂性能。总的来说，作为一种创新型仿生膜，PermeaPad®是一种很有前景且可以快速、经济、可靠地筛选药物制剂和化合物渗透性的科研工具。

PermeaPad®有两种规格：PermeaPad®Barrier 和 PermeaPad®Plate。



PermeaPad®Barrier 用于预测颊部吸收的有效性。科研人员以美托洛尔为例，在 pH 值 7.4,8.5,9.0 和 9.5 时使用 PermeaPad®Barrier 分别进行渗透率测定。经证实，PermeaPad®Barrier 不仅能够耐受这些条件，并且如预期的那样，随着 pH 值的增加，渗透率明显提高（见 Table1）。科研人员将渗透结果与相同配方的体外、间接体外和体内研究结果进行了比较。结果表明，使用 PermeaPad®Barrier 考察美托洛尔的渗透性在间接体外和体外研究中都有很好的相关性($r^2 = 0.98$ 和 0.97)。此外，在比较美托洛尔对小型猪的口腔表观渗透系数和绝对生物利用度时，获得了极好的体内外相关性 IVIVC($r^2 = 0.98$)。结果表明，与其他方法相比，PermeaPad®Barrier 可快速且便捷得用于模拟美托洛尔的颊部吸收。



Permeapad®Barrier 用于开发鼻-脑靶向给药的脂质体制剂。研究目的是阐明离子强度对大单胞囊(LUVs)药物释放变化的影响背后的动力学。为此，我们研究了两种不同的模型药物(咖啡因和氢化可的松)通过具有不同保留性能的不同类型棒状体(再生纤维素和新引入的仿生屏障通透 Permeapad®)转入脂质体的过程。用标准的 Franz 扩散池研究了脂质体的药物释放。将 LUV 分布暴露于等渗、低渗和高渗环境(初始 LUV 与环境的差异为 300mOsm/kg)和线性和非线性(korsmemeyer- peppas)回归模型处理的实验数据中。为了改变脂质体膜的硬度，胆固醇被引入脂质体屏障中(高达

25%w/w)。Korsmeyer-Peppas 模型被证明适用于分析整个实验时间框架的实验数据，提供了重要的附加信息的对比标准线性逼近。所获得的结果是高度相关的，因为它们改善了渗透胁迫下 LUVs 的药物释放动力学。此外，该发现可用于开发鼻-脑靶向给药的脂质体制剂。

PermePad®Barrier 也可应用在多种装置中测试。如应用在 Franz 扩散池上或者 LOGAN Permetro 系统中，都可测试药物制剂的渗透吸收。

PermeaPad®Plate 更适用于高通量筛选化合物或者药物分子的渗透性能，在 96 孔板中进行实验，简捷、快速、重复性好且可以单独使用。



