



嘉法狮药用辅料产品目录

口服给药

外用给药

直肠给药

阴道给药

非胃肠道给药





嘉法狮药用辅料产品目录

已获得登记号的辅料			
产品名称	登记号	状态	应用
Compritol 888 ATO 山嵛酸甘油酯	F20170000058	A 产地1	片剂润滑剂，缓释骨架，掩味
Compritol 888 ATO 山嵛酸甘油酯	F20190000560	I 产地2	片剂润滑剂，缓释骨架，掩味
Maisine CC 单亚油酸甘油酯	F20180000863	A	油相
Suppocire 混合脂肪酸甘油酯(硬脂)	F20190001132	A 产地1	栓剂基质，增稠剂
Suppocire 混合脂肪酸甘油酯(硬脂)	F20190001351	A 产地2	栓剂基质，增稠剂
Tefose 63 聚乙二醇-7硬脂酸酯	F20190001679	A	非离子型水包油乳化剂
Labrasol 辛酸癸酸聚乙二醇甘油酯	F20190001267	A	水分散性表面活性剂
Plurol Oleique CC 497 聚甘油脂肪酸酯	F20170000070	A	水不溶性表面活性剂，助表
Transcutol 二乙二醇单乙醚	F20190000521	I	溶媒，促透剂
Geleol Mono and Diglycerides NF 单双硬脂酸甘油酯	F20190000559	A 产地1	增稠剂，助乳化剂，包衣抗粘剂
Geleol Mono and Diglycerides NF 单双硬脂酸甘油酯	F20190000746	I 产地2	增稠剂，助乳化剂，包衣抗粘剂
Peceol 单油酸甘油酯	F20200000253	I	油相
Lauroglycol™ FCC 月桂酸丙二醇酯 (I)	F20210000305	A	水不溶性表面活性剂，助表，油性载体
Lauroglycol™ 90 月桂酸丙二醇酯 (II)	F20220000058	I	水不溶性表面活性剂，助表，油性载体
Labrafil® M 1944 CS 油酰聚氧乙烯甘油酯	F20210000065	I	水分散性表面活性剂，助表
Gelucire® 44/14 月桂酰聚氧乙烯 (32) 甘油酯	F20210000519	I	水分散性表面活性剂
Capryol® 90 单辛酸丙二醇酯	F20220000076	I	水不溶性表面活性剂，助表，油性载体
Precirol® ATO 5 双硬脂酸甘油酯	F20230000202	I	润滑剂，缓释骨架，掩味
Gelucire® 48/16 聚氧乙烯 (32) 硬脂酸酯	F20230000203	I	水分散性表面活性剂



咨询电话：021-55807300 18917855515

用于口服制剂的脂质辅料

口服给药

外用给药

直肠给药

阴道给药

非胃肠道给药



关于嘉法狮

嘉法狮是油脂辅料主流供应商，在全球范围内为医药行业提供辅料和处方解决方案。我们公司拥有超过140年的历史，一直承诺为客户提供创新产品以及相关的应用技术指导。在开发独特产品以及新应用的同时，嘉法狮致力于确保产品的药品品质。

嘉法狮脂质辅料

用于生产嘉法狮辅料的油脂和脂肪酸均严格来源于植物原料。

嘉法狮的脂质辅料是通过脂肪酸与醇类（如甘油、聚乙二醇、丙二醇或聚甘油）经酯化反应得到的酯化物，或是将植物油与甘油、聚乙二醇、丙二醇经醇解反应得到的酯化物。

油脂化学的专业知识使我们能够开发出一系列具有不同热力学、流变性和结构特性以及广泛溶解度特性的功能性辅料。

口服脂质辅料

我们的功能性脂质辅料，能应对在药品开发中遇到的最棘手的问题，这些问题包括药物溶解度、渗透性和低生物利用度、调节药物释放行为、保护敏感型药物和掩味。在生产中，脂类辅料在片剂润滑方面提供优势，它们的多功能性意味着能被用于多种生产工艺，提供了制剂的创新空间。

缩写

API: 活性药用成分;

Ch.P.: 中国药典;

EP: 欧洲药典;

HLB: 亲水亲油平衡值;

JPE: 日本药用辅料;

LFCS: 脂质处方分类体系;

USP-NF: 美国药典-国家处方集;

S(M)EDDS: 自(微)乳化给药系统



内容



4 用于延缓药物释放的辅料

6 用于增溶和提高药物生物利用度的辅料

8 用于掩味和保护药物的辅料

10 用作片剂和胶囊剂润滑剂的辅料

11 技术支持

用于延缓药物释放的辅料

由于制备工艺灵活且能高效控制药物释放，骨架片是一种常用的调节药物释放的剂型。骨架片的制备工艺多样，可以采用简单物理混合后进行直接压片，或者采用固体分散体技术，所得缓释颗粒可进一步压片。

脂质辅料在多种缓释剂型中有使用历史：简单的缓释骨架片；复杂的给药系统，如复方药物缓释片，脉冲、择时和延时给药系统。

通过调节基本配方或者制备工艺参数，可以容易地调节甘油酯类辅料所制备的缓释片中药物的释放，以达到目标释放曲线。所得的脂质骨架不溶于水性体系，且不溶胀，其调节药物释放的机理是扩散。

高熔点、低HLB值的脂质辅料具有良好的塑性，可采用多种标准工艺制备骨架片（见表1）。此外，这些辅料具有化学惰性、无味无嗅，与其他辅料也有良好的相容性，如包衣所用高分子材料。

这些辅料的生物药剂学和生产优势如下：

+ 调节药物释放曲线更直接简单

+ 有效控制水溶性高、半衰期短药物的释放

+ 非pH、乙醇依赖性

+ 疏水性骨架，提高制剂存放稳定性

+ 制备过程不含溶剂，更清洁、环保

表1：用于延缓药物释放的辅料

产品	中英文化学名称	性状	HLB	熔点 (°C) (毛细管法)	滴点 (°C) (梅特勒法)	制备工艺
Compritol® 888 ATO	山嵛酸甘油酯 Glycerol dibehenate EP Glyceryl dibehenate NF	粉末*	2	65.0-77.0	69.0-74.0	直接压片 湿法制粒 固体分散体 热熔制粒 热熔挤出 喷雾冷凝 热熔包衣
Precirol® ATO 5	双硬脂酸甘油酯 Glycerol distearate (type I) EP Glyceryl distearate NF	粉末*	2	50.0-60.0	53.0-57.0	热熔挤出 热熔包衣 喷雾冷凝 胶囊灌注
Geleol™ Mono and Diglycerides NF	单双硬脂酸甘油酯 Glycerol monostearate 40-55 (type I) EP Mono and diglycerides NF	颗粒	3	54.0-64.0	54.5-64.5	热熔挤出 热熔包衣 胶囊灌注

* 粉末平均粒径50 µm

请与我们联系获得缓释制剂更多的宣传册

用于增溶和提高药物生物利用度的辅料

自乳化药物给药系统(表面活性剂/助表面活性剂/油性辅料的组合)可以为难溶性、脂溶性药物提供一种有效的增溶和提高生物利用度的方法,主要机理如下:

- 通过增加处方中药物的润湿性和溶解度,增加药物载药量
- 维持药物在胃肠道中“溶解”的状态,增加药物吸收
- 选择性地促进某些药物通过淋巴转运吸收
- 增加肠道的渗透性
- 减少食物的影响

通过单一或者联合使用,嘉法狮辅料在自(微)乳化处方中有众多应用,这些辅料HLB值从1到12,可以在处方中表现不同的性能。

- 通常,高HLB值的表面活性剂可以联合水不溶性表面活性剂、助表面活性剂和油相一起使用
- 低HLB值的水分散性表面活性剂通常与高HLB值的水分散性表面活性剂配合使用

表2: 嘉法狮增溶剂和脂质处方分类系统(LFCS)

产品	作用	脂质处方分类	水中溶解度	HLB
Gelucire® 48/16	水溶性表面活性剂	IV型处方, 胶束	透明胶束溶液	12
Gelucire® 44/14 Labrasol® ALF	水分散性表面活性剂	III型处方, 微乳	透明分散液	10 - 12
Labrafil® (s)	润湿剂	II型处方, 乳剂	乳白色分散液	7 - 9
Capryol® (s) Lauroglycol™ FCC Labrafac™ MC 60	水不溶性表面活性剂	II型和III型处方	分散液	5 - 6
Lauroglycol™ 90 Plurol® Oleique CC 497	水不溶性表面活性剂	II型和III型处方	不溶	2 - 4
Maisine® CC Peceol™	油相	I型、II型和III型处方	不溶	1

如需更多信息, 请参考手册《脂质处方(Lipid-based formulations)-改善药物口服生物利用度的制胜策略》。

表3：用于增溶和提高生物利用度用的辅料列表

产品	中英文化学名称	HLB	作用
Gelucire® 48/16	聚乙二醇硬脂酸酯 Macrogol stearate (type I) EP Polyoxyl stearate (type I) NF	12	水溶性表面活性剂
Labrasol® ALF	辛酸癸酸聚乙二醇甘油酯 Caprylocaproyl macrogol-8 glycerides EP Caprylocaproyl polyoxyl-8 glycerides NF	12	水分散性表面活性剂
Gelucire® 44/14	月桂酰聚氧乙烯(32)甘油酯 Lauroyl macrogol-32 glycerides EP Lauroyl polyoxyl-32 glycerides NF	11	
Gelucire® 50/13	硬脂酰聚氧乙烯(32)甘油酯 Stearoyl macrogol-32 glycerides EP Stearoyl polyoxyl-32 glycerides NF	11	
Labrafil® M 1944 CS	油酰聚氧乙烯甘油酯 Oleoyl macrogol-6 glycerides EP Oleoyl polyoxyl-6 glycerides NF	9	
Labrafil® M 2125 CS	亚油酰聚氧乙烯(6)甘油酯 Linoleoyl macrogol-6 glycerides EP Linoleoyl polyoxyl-6 glycerides NF	9	
Labrafil® M 2130 CS	月桂酰聚氧乙烯(6)甘油酯 Lauroyl macrogol-6 glycerides EP Lauroyl polyoxyl-6 glycerides NF	9	
Capryol® PGMC	辛酸丙二醇酯/单辛酸丙二醇酯 Propylene glycol monocaprylate (type I) NF	6	水不溶性表面活性剂
Capryol® 90	单辛酸丙二醇酯 Propylene glycol monocaprylate (type II) NF	5	
Labrafac™ MC 60	单双辛酸癸酸甘油酯/辛酸癸酸单双甘油酯 Glycerol monocaprylocaprate (type I) EP Glycerol Mono and Dicaprylocaprate NF	5	
Lauroglycol™ FCC	月桂酸丙二醇酯/单月桂酸丙二醇酯 Propylene glycol monolaurate (type I) EP/NF	5	
Lauroglycol™ 90	单月桂酸丙二醇酯 Propylene glycol monolaurate (type II) EP/NF	3	
Plurol® Oleique CC 497	聚甘油油酸酯/聚甘油脂肪酸酯 Polyglyceryl-3 dioleate NF	3	
Maisine® CC	单亚油酸甘油酯 Glycerol monolinoleate EP Glycerol monolinoleate NF	1	油相
Pecol™	单油酸甘油酯 Glycerol monooleate (type 40) EP Glycerol monooleate (type 40) NF	1	
Labrafac™ PG	二辛酸癸酸丙二醇酯 Propylene glycol dicaprylocaprate EP Propylene glycol dicaprylate/dicaprate NF	1	
Labrafac™ Lipophile WL 1349	中链甘油三酸酯 Triglycerides medium-chain EP Medium chain triglycerides NF	1	
Transcutol® HP	二乙二醇单乙醚 Highly purified diethylene glycol monoethyl ether EP/NF	/	溶剂

用于掩味和保护药物的辅料

一些辅料具有优秀的热塑性能，非常适合通过热熔工艺用于掩味和保护敏感的化合物。

高剪切包衣技术

这个技术可使用标准的高剪切混合机，无需配套加热和冷却系统。在一个简单的案例中，处方包含80%的API和20%的Precirol ATO 5这样简单的二元体系。

在混合过程中，摩擦产生的热量足以加热并使得部分脂质辅料熔融。熔融的辅料包裹在药物颗粒上，随着冷却固化覆盖于药物颗粒表面，并掩盖不良口感。

热熔包衣技术

熔融的脂质辅料通过流化床包衣设备被喷散在固体药物颗粒上。这些脂质辅料形成了一层细薄且均匀的包衣层，不仅使片剂更为紧实，还解决了药物掩味和相容性问题。该工艺较为快捷、无需使用溶剂且无需干燥。

使用的辅料与香精、聚合物、塑化剂和表面活性剂等有良好的相容性。例如，Compritol 888 ATO与20%的Labrasol ALF联合的脂质包衣，可以起到保护药物和调解药物释放的作用。

包衣后的药物可以用于制备片剂、软胶囊、硬胶囊和散剂。

热熔制粒

在高剪切混合并加热的条件下，脂质辅料在固体颗粒（药物和其它辅料）之间形成液体桥，充当粘合剂，制得小的颗粒。可以通过控制混合参数使这些颗粒形成较为圆整的粒子。这些具有热塑性的脂质辅料用量通常为15%到25%，根据颗粒大小不同有所区别。该工艺简单（一步法）且无需溶剂。

文献中描述，通过以上辅料理论上最高可达到85%的载药量，实际操作中载药量可达到66%。以上脂质颗粒可以用于压片和胶囊填充。

选择何种辅料取决于处方的目的，详见表4。

若需要更多关于热熔工艺的辅料信息，请咨询嘉法狮当地代表

表4：用于掩味和保护药物的辅料

产品	中英文化学名	形态	HLB	熔点 (°C) (毛细管法)	滴点 (°C) (梅特勒法)	相关工艺
掩味						
Precirol® ATO 5	双硬脂酸甘油酯 Glycerol distearate (type I) EP Glyceryl distearate NF	粉末*	2	50.0-60.0	53.0-57.0	热熔包衣 热熔制粒 热熔挤出 (热熔/部分 热熔)
Geleol™ Mono and Diglycerides NF	单双硬脂酸甘油酯 Glycerol monostearate 40-55 (type I) EP Mono and diglycerides NF	颗粒	3	54.0-64.0	54.5-64.5	热熔制粒 热熔挤出 (热熔/部分 热熔)
API保护 / 提高API相容性						
Compritol® 888 ATO	山嵛酸甘油酯 Glycerol dibehenate EP Glyceryl dibehenate NF	粉末*	2	65.0-77.0	69.0-74.0	热熔包衣 热熔制粒 热熔挤出 (热熔/部分 热熔)
Gelucire® 43/01	硬脂 Hard fat EP/NF/JPE	颗粒	1	/	42.5-46.0	胶囊灌装

* 平均粒径为 50 µm

用作片剂和胶囊剂润滑剂的辅料

有效的润滑作用对于片剂和胶囊剂产品的生产和质量控制有着较大的影响，尤其是对于产品外观和内容物均匀度。

嘉法狮的润滑剂通常用于解决粉体学性能差相关的问题。它们呈现为化学惰性，和几乎所有活性物及辅料有良好的相容性。

嘉法狮润滑剂其粒径经过精确控制，在压片和胶囊填充过程中可以提供优良的原料均匀度和混合均一性。

嘉法狮润滑剂的性能不受混合时间和混合速度的影响，使得片剂和胶囊的制备更加直接简单。

- **Compritol® 888 ATO** 推荐用于压片工艺中，可以提供足够的润滑作用且不会影响片剂性能。分散片中我们更推荐使用 Compritol® HD 5
- **Precirol® ATO 5** 提供了优良的抗摩擦特性，是胶囊灌装的理想润滑剂

表5: Gattefossé 提供用于片剂和胶囊剂的润滑剂

产品	中英文化学名称	形态	HLB	滴点 (°C) (梅特勒法)
片剂润滑剂				
Compritol® 888 ATO	山嵛酸甘油酯 Glycerol dibehenate EP Glyceryl dibehenate NF	粉末*	2	69.0-74.0
Compritol® HD5 ATO	PEG-8山嵛酸甘油酯 Behenoyl polyoxyl-8 glycerides NF	粉末*	5	60.0-67.0
胶囊润滑剂				
Precirol® ATO 5	双硬脂酸甘油酯 Glycerol distearate (type I) EP Glyceryl distearate NF	粉末*	2	53.0-57.0

* 平均粒径为 50 µm

