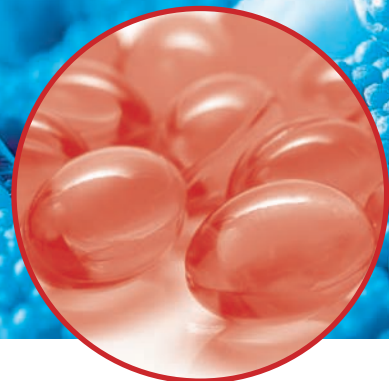


PHARMACEUTICAL PERFORMANCE POWERED BY GATTEFOSSÉ

法国嘉法狮公司药用辅料

口服制剂脂质辅料



关于嘉法狮

嘉法狮公司是世界上功能性脂质辅料和脂质技术领先的革新者和领导者。我们公司拥有超过100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用品质。

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绝大多数棘手的问题，如提高药物溶解度、生物利用度；为得到更好的治疗效果而改变药物释放行为；为了提高病人顺应性而进行的掩味处理等。同时脂质辅料还可以应对敏感活性药物的稳定性问题以及实际生产过程中的润滑问题。

嘉法狮脂质辅料

用于生产嘉法狮辅料的油脂或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）酯化得到的酯化物，或是将植物油、脂肪的醇解物与甘油、聚乙二醇、丙二醇酯化得到的酯化物。

根据不同长度不同类型的脂肪酸、酯化的程度以及两性基团的大小性质，我们制备出具有不同热塑性质和广泛溶解特性的脂质辅料。

由于具有不同的理化性质，嘉法狮的脂质辅料能解决在处方研究中遇到的各种问题，如溶解性、渗透性以及调节药物释放行为。

嘉法狮的脂质辅料与各种活性药物之间具有良好的相容性。



内容

> 缓释基质	4-5
> 生物利用度和溶解度增强剂	6-7
> 掩味剂或活性成分保护剂.....	8-9
> 片剂和胶囊的润滑剂	10
> 其他	11

缓释基质

嘉法狮脂质辅料为开发有效的缓释剂型提供简便的解决方法。

- ◆ 与pH无关的药物释放动力学，可避免药物突释
- ◆ 与API或其他功能性辅料具有良好的相容性
- ◆ 处方技术简单，药物释放稳定
- ◆ 使用常规实验室和生产设备
- ◆ 无溶剂操作，生产更简洁

产品	化学定义	法规状态	HLB值	熔点℃
缓释基质				
¹ Compritol®888 ATO	山嵛酸甘油酯 Glycerol dibehenate EP Glyceryl behenate NF	IIG/JSFA FCC/GRAS	2	70
Precirol® ATO 5	双硬脂酸甘油酯 Glycerol distearate (type I) EP Glyceryl distearate NF	E471/FCC/GRAS JSFA	2	56
Geleol™ Mono and Diglycerides NF	单硬脂酸甘油酯 Glycerol monostearate (type I) EP Mono and diglycerides NF	IIG/JSFA E471/FCC/GRAS	3	56.5 ²
Gelucire® 39/01	硬脂 Hard fat EP/NF	IIG/JSFA JPED/DSHEA	1	39
Gelucire® 43/01	硬脂 Hard fat EP/NF	IIG/JSFA JPED/DSHEA	1	43
Gelucire® 50/13	硬脂酸聚乙二醇甘油酯 Stearoyl macrogol-32 glycerides EP Stearoyl polyoxyl-32 glycerides NF	IIG USFA	13	50

¹与颗粒形式相同: Compritol®888 pellets

²熔点 (毛细管法) 54.0 to 64.0°C

技术支持

如需获得以下信息，请与嘉法狮分公司联系：

- 开发缓控释制剂的指导
- 有关产品使用、常规以及毒理信息的进一步了解
- 应用实验室提供细节的技术服务

推荐的处方技术

压片	喷雾冷却	熔融制粒 熔融挤出	胶囊灌注
✓	✓	✓	
	✓	✓	✓
	✓	✓	✓
		✓	✓
		✓	✓
			✓

溶解度和生物利用度增强剂

嘉法狮脂质辅料可提供提高API水中溶解度的有效策略。以脂质为基础的处方可以保证或增加口服生物利用度来改善药物在体内的传递。

低HLB值的油相可用在高脂溶性API的处方设计中。如果需要使用表面活性剂来提高API在水中的溶解度，可以开发包含一种或多种脂质辅料的自乳化（SELF）处方。

产品	化学定义	法规状态	HLB值
表面活性剂			
Gelucire® 44/14	月桂酸聚乙二醇甘油酯	IIG	14
	Lauroyl macrogol-32 glycerides EP	USFA	
	Lauroyl polyoxyl-32 glycerides NF		
Gelucire® 50/13	硬脂酸聚乙二醇甘油酯	IIG	13
	Stearoyl macrogol-32 glycerides EP	USFA	
	Stearoyl polyoxyl-32 glycerides NF		
Labrafil® M 2130 CS	月桂酸聚乙二醇-6甘油酯	IIG	4
	Lauroyl macrogol-6 glycerides EP		
	Lauroyl polyoxyl-6 glycerides NF		
Labrafil® M 1944 CS	油酸聚乙二醇甘油酯	IIG	4
	Oleoyl macrogol-6 glycerides EP		
	Oleoyl polyoxyl-6 glycerides NF		
Labrafil® M 2125 CS	亚油酸聚乙二醇甘油酯	IIG	4
	Linoleoyl macrogol-6 glycerides EP		
	Linoleoyl polyoxyl-6 glycerides NF		
Labrasol®	辛酸癸酸聚乙二醇甘油酯	IIG	14
	Caprylocaproyl macrogol-8 glycerides EP		
	Caprylocaproyl polyoxyl-8 glycerides NF		
助表面活性剂			
Capryol™ PGMC	丙二醇单辛酸酯	IIG	5
	Propylene glycol monocaprylate (type I) NF	FCC/USFA/JSFA	
Capryol™ 90	丙二醇单辛酸酯	IIG	6
	Propylene glycol monocaprylate (type II) NF	FCC/USFA/JSFA	
Lauroglycol™ FCC	丙二醇单月桂酸甘油酯	IIG/JSFA	4
	Propylene glycol monolaurate (type I) EP/NF	E477/FCC/USFA	

产品	化学定义	法规状态	HLB值
Lauroglycol™ 90	丙二醇单月桂酸甘油酯 Propylene glycol monolaurate(type II) EP/NF	IIG/JSFA E477/FCC/USFA	5
Plurol® Oleique CC497	聚甘油油酸酯 Polyglyceryl-3 dioleate	IIG/JSFA E475/FCC/USFA	6
液体油相			
Labrafac™ PG	丙二醇双癸酸酯 Propylene glycol dicaprylocaprate EP Propylene glycol dicaprylate/dicaprate NF	IIG/JSFA E477/FCC/USFA	2
Labrafac™ Lipophile WL 1349	中链甘油三酯 Triglycerides medium-chain EP Medium-chain triglycerides NF	IIG/JSFA JPED/DSHEA	1
Maisine™ 35-1	单亚油酸甘油酯 Glycerol monolinoleate EP Glyceryl monolinoleate NF	IIG/JSFA E471/FCC/GRAS	4
Peceol™	单油酸甘油酯 Glycerol monooleates (type 40) EP Glyceryl monooleate (type 40) NF	IIG/JSFA E471/FCC/GRAS	3
液体溶剂			
Transcutol® HP	二乙二醇单乙基醚 Highly purified diethylene glycol monoethylether EP/NF	IIG	/

简单的处方技术：可用常规实验室和生产设备

以上所列辅料均可灌入硬或软胶囊中。

通过引入惰性的固体吸收剂，可将液体半固体辅料制备成片剂。

通过热处理或溶剂蒸发的方式，可将半固体辅料制成颗粒。

- ◆ 胶囊灌注
- ◆ 惰性固体吸收



可用在SELF中的辅料
表面活性剂
助表面活性剂
油相
溶剂

- ◆ 热熔制粒、热熔挤出
- ◆ 溶剂蒸发



半固体辅料
Gelucire® 44/14
Gelucire® 50/13

技术支持

如需获得以下信息，请与嘉法狮分公司联系：

- 手册《脂质辅料在提高生物利用度上的应用》
- 有关产品使用、常规以及毒理信息的进一步了解
- 应用实验室提供细节的技术服务

掩味及保护剂

脂质辅料可提供有效的掩味效果，以替代使用聚合物
脂质辅料优点：

- ◆ 可在脂质衣膜中联合使用其他功能性辅料
- ◆ 更好的API可压性
- ◆ 无溶剂操作，生产更简洁

脂质辅料是敏感API有效的给药载体

产品	化学定义	法规状态	HLB值	熔点°C
掩味剂				
Biogapress™ Vegetal BM 297 ATO	双棕榈酸硬脂酸甘油酯 Glyceryl dipalmitostearate	IIG/JSFAUSFA E471/FCC/GRAS	2	57
Geleol™ Mono and Diglycerides NF	单硬脂酸甘油酯 Glycerol monostearate (type I) EP Mono and diglycerides NF	IIG/JSFA E471/FCC/GRAS	3	56.5 ²
Precirol® ATO 5	双硬脂酸甘油酯 Glycerol distearate (type I) EP Glyceryl distearate NF	E471/FCC/GRAS JSFA	2	56
保护剂				
Gelucire® 33/01	硬脂 Hard fat NF	IIG/JSFA Hard fat NF	1	33
Gelucire® 39/01	硬脂 Hard fat EP/NF	IIG/JSFA JPED/DSHEA	1	39
Gelucire® 43/01	硬脂 Hard fat EP/NF	IIG/JSFA JPED/DSHEA	1	43

²熔点（毛细管法）54.0 to 64.0° C

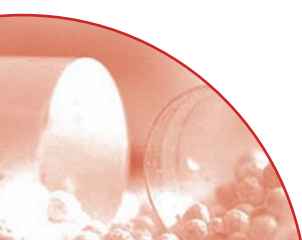


技术支持

如需获得以下信息，请与嘉法狮分公司联系：

- 开发实际处方的指导
- 有关产品使用、常规以及毒理信息的进一步了解
- 应用实验室提供细节的技术服务

推荐的处方技术		
喷雾冷却	熔融制粒 熔融挤出	胶囊灌注
✓	✓	
	✓	
✓	✓	
	✓	✓
	✓	✓
	✓	✓



片剂和胶囊润滑剂

嘉法狮的润滑剂是喷雾干燥而得、细小的球型粉末，可保证在混合过程中优良的均匀性以及批与批之间一致性、更好的重现性。

经过多次试验，脂质的润滑剂具有以下优点：

- ◆ 改善粘合特性
- ◆ 不会降低片剂硬度，不影响片剂崩解时限以及溶出度
- ◆ 润滑性能与混合时间、混合速度无关，使小试、中试、生产之间的技术衔接更为简单。

产品	化学定义	法规状态	HLB值	熔点℃
润滑剂				
Compritol®888 ATO	山嵛酸甘油酯 Glycerol dibehenate EP Glyceryl behenate NF	IIG/JSFA FCC/GRAS	2	70
³ Compritol® HD5 ATO	聚乙二醇-8 山嵛酸甘油酯 Behenoyl polyoxyl-8 glycerides NF		5	64
Compritol® E ATO	双山嵛酸甘油酯 Glyceryl dibehenate	IIG/JSFA E471/FCC/GRAS	2	74
Precirol® ATO 5	双硬脂酸甘油酯 Glycerol distearate (type I) EP Glyceryl distearate NF	E471/FCC/GRAS JSFA	2	56
Biogapress™ Vegetal BM 297 ATO	双棕榈酸硬脂酸甘油酯 Glyceryl dipalmitostearate	IIG/JSFA E471/FCC/GRAS	2	57

技术支持

如需获得以下信息，请与嘉法狮分公司联系：

- 手册《优良的片剂和胶囊润滑剂》
- 有关产品使用、常规以及毒理信息的进一步了解
- 应用实验室提供细节的技术服务

³ Compritol® HD5 ATO 是一种用于泡腾片/口溶片中的润滑剂

其他信息

样品和包装

本手册中提到的辅料均有样品提供。工业包装大小有1、5、10、25、180、200kg.

药物主文件 (DMF)

在美国FDA 注册的IV类药物主文件:

Capryol™ 90, Capryol™ PGMC, Compritol® 888 ATO , Compritol® 888 pellets, Compritol® HD 5 ATO, Geleol™ Monoet diglycerides NF, Gelucire® 44/14, Gelucire® 50/13, Labrafac™ Lipophile WL 1349, Labrafil® M 1944CS, Labrafil® M 2125CS, Labrafil® M 2130 CS, Labrasol®, Lauroglycol™ 90, Lauroglycol™ FCC, Maisine™ 35-1, Peceol™, Precirol® ATO 5, Transcutol® HP.

缩写

DSHEA = 饮食补充剂健康与教育法

EP = 欧洲药典

FCC = 食品化学品法规

GRAS = 一般认为安全

IIG = 非活性成分指南

JPED = 日本药用辅料目录

JSFA = 日本食品添加剂标准

NF = 美国国家处方集

SEDDS = Self Emulsifying Drug Delivery System

SMEDDS = Self Micro Emulsifying Drug Delivery System

USFA = 美国食品添加剂.

Compritol®, Gelucire®, Labrasol®, Labrafil®, Plurol®, Precirol®, Transcutol®, 为嘉法狮注册商标。

本手册中包含的信息是真实的，我们确信是正确的，但我们对结果的准确度或特殊应用的适合性不提供保证，也不暗示免除专利侵权。它仅仅供您考查、研究和确认。使用者应在其职责范围内确定信息的使用和安全条件，在出现损害性后果的情况下将成为唯一的责任人。在使用嘉法狮的产品或本手册中提到的其它任何产品之前，请阅读、理解和遵守最新《化学品安全技术说明书》中包含的信息。

WORLDWIDE LOCATIONS



CORPORATE & HEADQUARTERS

Gattefossé: 36 chemin de Genas - BP 603 - F-69804 SAINT-PRIEST Cedex - FRANCE

Tel: +33 4 72 22 98 00 – Fax: +33 4 78 90 45 67

E-mail: infopharma@gattefosse.com

Gattefossé 是一家总部位于法国，有着 130 多年历史的私营跨国企业，致力于研发、生产和销售用于医药和个人护理行业的专用成分。

Gattefossé 公司在脂质化学、生物学和天然原料提取技术领域享有独到的技术和优势。如今产品热销至全球 50 多个国家和地区。

Gattefossé 一直致力于向医药行业提供创新的功能性脂质药用辅料，可广泛用作：

- 缓释基质
- 乳化剂
- 润滑剂
- 促渗剂
- 掩味剂
- 高效溶剂
- 增溶剂
- 栓剂基质



嘉法狮（上海）贸易有限公司
Gattefossé China Trading Co., Ltd.

如需详细资料与样品，请联系：

技术咨询（口服）

电话：021- 5895 8010-803

传真：021- 5895 8015

邮箱：jyang@gattefossecn.com

技术咨询（外用/腔道）

电话：021- 5895 8010-802

传真：021- 5895 8015

邮箱：carolw@gattefossecn.com

商务咨询

电话：010-5134 9100 021-58958010-806

传真：010-5134 9101

邮箱：eileenliu@gattefossecn.com
jacobyu@gattefossecn.com

地址：上海市浦东新区张江高科毕升路 289 弄 6 号楼 302 室

邮编：201204

网址：www.gattefosse.com