

药用辅料

METOLOSE®

甲基纤维素
羟丙甲纤维素
USP, EP, JP

METOLOSE® SR

羟丙甲纤维素
USP, EP, JP

PHARMACOAT®

羟丙甲纤维素
USP, EP, JP

HPMCP

邻苯二甲酸羟丙甲纤维素酯
NF, EP, JP

Shin-Etsu AQOAT®

醋酸羟丙甲纤维素琥珀酸酯
NF, JP

L-HPC

低取代羟丙纤维素
NF, EP, JP

产品信息

信越化学已为制药工业引入了多种药用辅料。下表显示了药用辅料不同属性的值。

型号	规格	参考数据
----	----	------

请在单独的手册中查找详细信息。

每个手册可以从网址<http://www.metolose.jp/en>中获得。

<薄膜包衣剂，粘合剂>

PHARMACOAT[®] 羟丙甲纤维素，USP，EP，JP

型号	粘度 (mPa·s) *	取代类型	甲氧基含量 (%)	羟丙氧基含量 (%)
603	2.4 - 3.6	2910	28.0 - 30.0	7.0 - 12.0
645	3.6 - 5.1			
606	4.8 - 7.2			
615	12.0 - 18.0			

*20°C，2%（质量分数）水溶液的粘度。

特点：

- 低粘度，适用于水或溶剂（水和乙醇的共溶剂）包衣体系的薄膜包衣。
- 水溶性和非离子型，与原料药（API）的相互作用较小。
- 可用作湿法制粒的粘合剂。低粘度和水溶性聚合物，有助于获得粒径均匀和流动性好的颗粒。
- 也可用作固体分散体载体。

<糖包衣粘合剂>

SB-4 羟丙甲纤维素，USP，EP，JP

型号	粘度 (mPa·s) *	取代类型	甲氧基含量 (%)	羟丙氧基含量 (%)
SB-4	3.2 - 4.8	2208	19.0 - 24.0	4.0 - 12.0

*20°C，2%（质量分数）水溶液的粘度。

特点：

- 代替明胶，可用作糖包衣的粘合剂。与明胶相比，SB-4具有更好的稳定性。

<增稠剂>

METOLOSE[®] 羟丙甲纤维素，甲基纤维素，USP，EP，JP

型号*		通用名	甲氧基含量（%）	羟丙氧基含量（%）
SM	4, 15, 25, 100, 400, 1500, 4000	甲基纤维素	26.0 - 33.0	-
60SH	50, 4000, 10000	羟丙甲纤维素2910	28.0 - 30.0	7.0 - 12.0
65SH	50, 400, 4000	羟丙甲纤维素2906	27.0 - 30.0	4.0 - 7.5
90SH	4000, 15000, 100000	羟丙甲纤维素2208	19.0 - 24.0	4.0 - 12.0

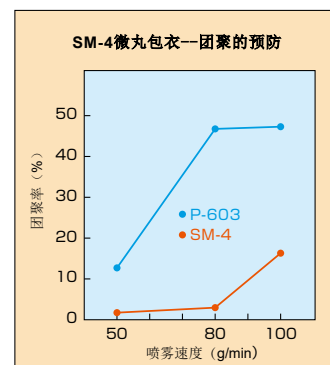
*表中的数值是20°C，2%（质量分数）水溶液的粘度。

特点：

- 具有不同粘度的非离子型水溶性聚合物。
- 用作液体制剂的分散剂。
- 由于SM-4粘性较低，推荐用于微丸包衣。即使在很高的喷雾速度下，这种热凝胶也有助于防止包衣过程中的团聚。

将从直径为1.0 mm的喷嘴中挤出的微丸，用7%的SM-4水溶液包衣，并将结果与在流化床制粒机中采用PHARMACOAT[®] 603（P-603）包衣的结果进行比较。

当喷雾速度从50 g/min变为100 g/min时，通过16号筛上物的重量分析团聚微丸的比例。



<缓释剂>

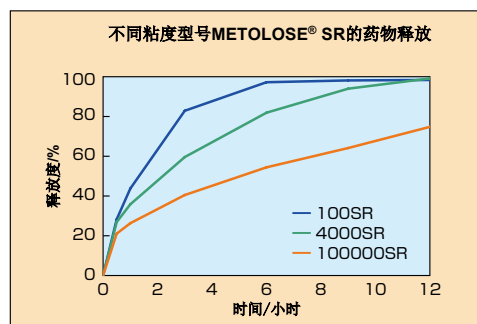
METOLOSE® SR 羟丙甲纤维素, USP, EP, JP

型号		粘度 (mPa·s) *	取代类型	甲氧基含量 (%)	羟丙氧基含量 (%)	颗粒尺寸 (μm)
90SH	100SR	80 - 120	2208	22.0 - 24.0	8.5 - 10.5	D_{20} : 20 - 40 D_{50} : 50 - 80 D_{80} : 100 - 160
	4000SR	3000 - 5600				
	15000SR	11250 - 21000				
	100000SR	75000 - 140000				

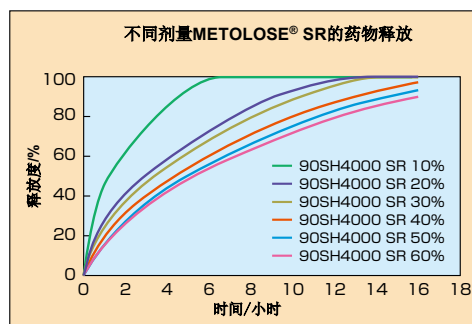
*20°C, 2% (质量分数) 水溶液的粘度。

特点:

- 用于API和METOLOSE® SR的亲水性基质处方, 以延长溶出。剂型可通过直接压片或制粒工艺获得。
- METOLOSE® SR具有适合持续释放应用的粒径型号。
- 通过选择合适的型号, 可以很容易地调整溶出曲线。
- 为了形成稳定的凝胶层, 处方中推荐METOLOSE® SR的量应大于20%。



处 方: 茶碱 429 mg
 METOLOSE® SR 48 mg
 硬脂酸镁 3 mg
 制 备: 直接压片
 试验介质: 水



处 方: 茶碱 10 mg
 METOLOSE® 4000 SR } 467 mg
 乳糖 }
 硬脂酸镁 3 mg
 制 备: 直接压片
 试验介质: 水

<肠溶包衣剂, 固体分散体载体>

HPMCP 邻苯二甲酰羟丙甲纤维素酯, NF, EP, JP

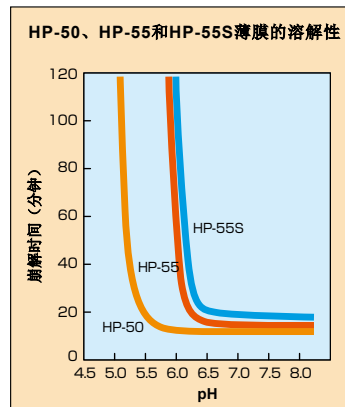
型号	邻苯二甲酰基 (%)	粘度 (mPa·s) *	pH溶解性
HP-50	21.0 - 27.0	44-66	≥ 5.0
HP-55	27.0 - 35.0	32-48	≥ 5.5
HP-55S		136-204	

*20°C, 10% (质量分数) 甲醇/二氯甲烷溶液的粘度。

特点:

- 适用于有机包衣体系。建议使用乙醇和水的混合物 (80/20, 质量比) 或丙酮和水的混合物 (95/5, 质量比), 作为共溶剂。
- 相对稳定, 不易水解。
- 可用作固体分散体, 以提高溶解性。

根据崩解试验方法, 测定有机溶剂浇铸膜的溶解时间 (厚度: 100 μm; 尺寸: 10 x 10 mm)
 ~ pH 5.6: 美国药典邻苯二甲酸盐缓冲液
 pH 5.8 ~: 美国药典磷酸盐缓冲液



<肠溶包衣剂，固体分散体载体>

Shin-Etsu AQOAT[®] 醋酸羟丙甲纤维素琥珀酸酯，NF，JP

型号	粘度* (mPa·s)	甲氧基含量 (%)	羟丙氧基含量 (%)	乙酰基含量 (%)	琥珀酰基含量 (%)	颗粒	pH溶解性
AS-LF	2.4 - 3.6	20.0 - 24.0	5.0 - 9.0	5.0 - 9.0	14.0 - 18.0	细颗粒**	≥ 5.5
AS-LG						粗颗粒	
AS-MF		21.0 - 25.0	5.0 - 9.0	7.0 - 11.0	10.0 - 14.0	细颗粒**	≥ 6.0
AS-MG						粗颗粒	
AS-HF		22.0 - 26.0	6.0 - 10.0	10.0 - 14.0	4.0 - 8.0	细颗粒**	≥ 6.5
AS-HG						粗颗粒	

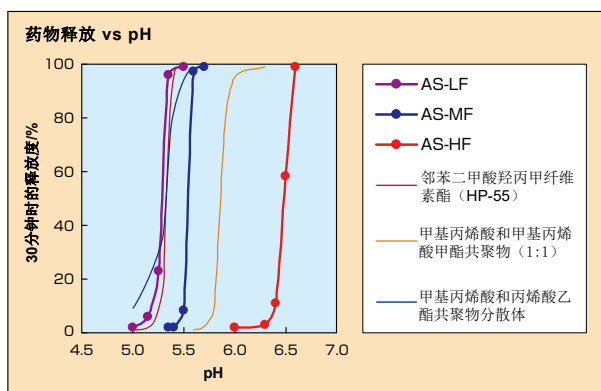
*20°C，2%（质量分数）氢氧化钠溶液的粘度

**D₅₀：不超过10 μm，D₉₀：不超过20 μm，激光衍射法

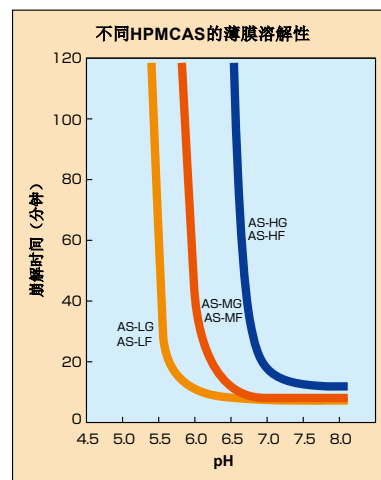
缩写：HPMCAS

特点：

- 对于肠溶包衣，可以采用不同的包衣方法，如水溶液包衣、有机溶剂包衣、氨中和包衣和干法包衣。可以根据API的特性选择包衣方法。例如，干法包衣适用于对水和溶剂敏感的API。



将核黄素颗粒用不同的肠溶包衣剂进行包衣。在美国药典邻苯二甲酸盐缓冲液（~pH5.6）和美国药典磷酸盐缓冲液（pH5.8~）中测定30分钟时核黄素的释放百分比。



根据崩解试验方法，测定有机溶剂浇铸膜的溶解时间（厚度：100 μm；尺寸：10 x 10 mm）
~pH 5.6：美国药典邻苯二甲酸盐缓冲液
pH 5.8 ~：美国药典磷酸盐缓冲液

- Shin-Etsu AQOAT[®]不仅适用于肠溶包衣，也适用于控制释放。它还可以用于固体分散体，以提高溶解度和生物利用度。

为制备固体分散体，可采用不同方法，例如喷雾干燥、喷雾包衣、热熔挤出（HME）、共沉淀等。因为Shin-Etsu AQOAT[®]可溶于各种有机溶剂，并且具有较低的玻璃化转变温度（T_g），所以是固体分散体中最合适的聚合物之一。许多科学论文报道，与其它聚合物相比，Shin-Etsu AQOAT[®]能够更有效地增强药物溶解度。

不同纤维素聚合物的玻璃化转变温度（T_g）

HPMCAS（所有型号）	122°C
HPMCP（HP-55）	138°C
HPMC（PHARMACOAT [®] 606）	150°C

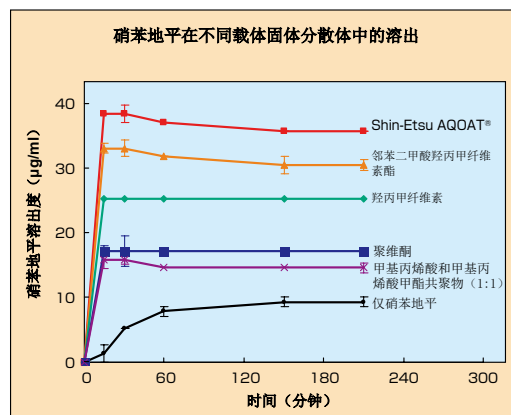
玻璃化转变温度（T_g）通过差示扫描量热法（DSC）在以下测试条件下确定的：

仪器：DSC Q2000（TA仪器，日本），

加热速率：10°C/min，

指的是第二次运行的氮气气氛

样品尺寸：3 mg



将硝苯地平（NP）和各种载体按照NP/载体的重量比= 1:2溶于有机溶剂中，然后喷雾、干燥和研磨。
用模拟肠液（pH 6.8）进行溶出度测试。

<崩解剂，抗顶裂剂>

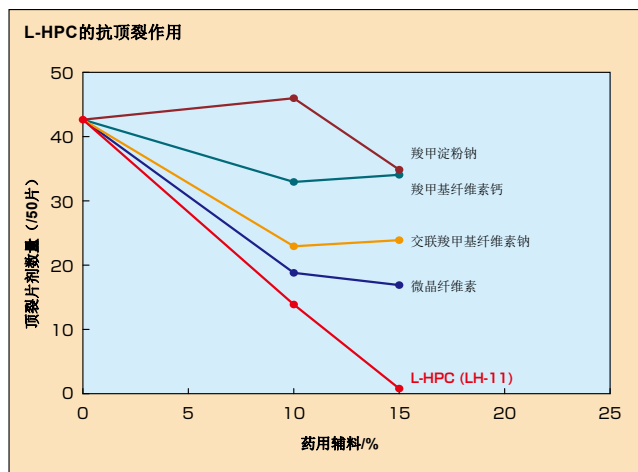
L-HPC 低取代羟丙纤维素，NF，EP，JP

型号	羟丙氧基含量 (%)	平均粒径* (μm)	90%累计粒径* (μm)	应用
LH-11	10.0 - 12.9	45-65	150-200	直接压片 (DC)，抗顶裂
LH-21		35-55	100-150	DC，制粒 (高效剪切)
LH-22	7.0 - 9.9			DC，制粒 (高效剪切)
LH-B1	10.0 - 12.9	45-65	100-150	DC，制粒 (流化床)
LH-31		17-23	40-100	制粒 (高效剪切，挤出)，药物层积
LH-32	7.0 - 9.9			制粒 (高效剪切，挤出)，药物层积
NBD-020	13.0 - 15.9	35-55	70-130	制粒 (高效剪切)
NBD-021	10.0 - 12.9			DC，制粒 (高效剪切)
NBD-022	7.0 - 9.9			DC，口腔崩解片

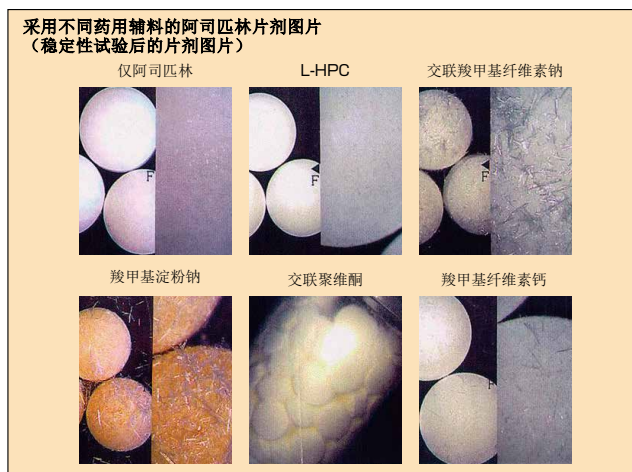
*信越激光衍射法

特点:

- 水不溶性，在水中溶胀，作为双功能组分，用于片剂及丸剂的崩解剂和粘合剂。
- 根据工艺和API的特性，可以选择合适的型号。
- 非离子型聚合物，与API的相互作用较小，稳定性较好。



制备含有不同比例药用辅料的乙水杨酸片，并根据美国药典方法进行脆碎度试验。

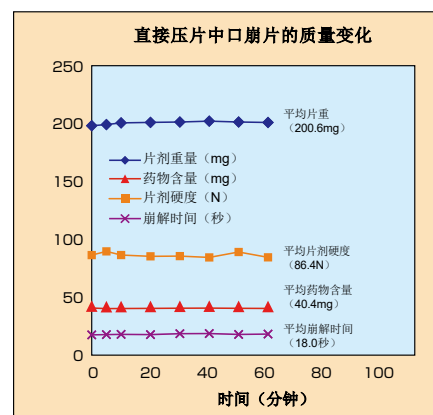


将含有20%药用辅料的阿司匹林片，在50℃下储存在密闭塑料瓶中3个月。

- NBD型号具有更窄的粒度分布和更好的流动性，因此适合直接压片。它们能够减少片剂重量和含量均匀度的偏差。
- NBD型号可以迅速溶胀（特别是NBD-022型号），因此也适合于口腔崩解片（ODT）制剂。ODT可以通过直接压片和喷雾造粒的方法制备，其中填充剂与NBD的分散体一起造粒。

片剂处方
 扑热息痛20%
 造粒甘露醇
 (Granulol®S)69.5%
 NBD-02210%
 硬脂酸镁0.5%

将所有组分充分混合并压制直径为8 mm，重量为200 mg的片剂。
 压片压力：预压3 kN，主压10 kN
 转速：40 rpm
 每隔5~10分钟取10片，分析片重、片剂硬度水中的崩解时间和药物含量。



信越化学药用辅料应用指南

此表概述了我们的纤维素产品在医药应用中的一般方面。

具体处方请咨询我们的销售部门或您所在地区的经销商。

◎= 非常适合 ○= 适合

		片剂														微丸																		
		薄膜包衣 ¹⁾ 掩味 ²⁾	肠溶包衣	肠溶包衣 溶剂	糖包衣	水分散体&干粉包衣	持续释放	pH依赖性	粘合剂溶液	迅速崩解 ³⁾	快速溶出 ⁴⁾	干粘合剂 ⁵⁾	抗顶裂	口腔崩解片	薄膜包衣 ⁶⁾ 掩味	肠溶包衣	肠溶包衣 溶剂	水分散体&干粉包衣	持续释放	pH依赖性	快速溶出	微丸挤出	粉末涂层	增稠剂	滴眼液 ⁷⁾	助悬剂	干糖浆剂	膏剂/皮肤贴剂	薄膜制备	胶囊制备	分散助剂	固体分散剂		
PHARMACOAT®	603	○						◎						○												◎							◎	
	645	◎	◎					○																		○			○	○			○	
	606	◎	◎					◎																		○		◎	○				◎	
	615	◎	◎					◎																		○		○	○				◎	
	SB-4					◎																							○					
METOLOSE®	SM-4		◎											◎	○														○					
	其它SM系列							◎															◎		◎	○	○							
	60SH's						◎	○															◎	○	○		○	◎						
	65SH's							○															○		◎									
	90SH's						○																○		○		○	○						
METOLOSE® SR	所有型号					◎																					○							
HPMCP	所有型号		◎	◎											◎	◎		○															◎	
Shin-Etsu AQOAT®	LF		◎		◎										◎		◎	○															○	
	MF		◎		◎										◎		◎	○															○	
	HF		○		○										○		○	◎															○	
	LG		◎	◎											◎	◎		○															◎	
	MG		◎	◎											◎	◎		○															◎	
	HG		○	○											○	○		◎															◎	
L-HPC	LH-11								○	○	○	◎																						
	LH-21								○	○	○	○																				○		
	LH-22								○	○	○	○																						
	LH-B1								◎	◎																						◎		
	LH-31										◎		○						○	◎	◎													
	LH-32										◎		○						○	◎	◎													
	NBD-022								◎	○	◎	○	◎						○	○	○													
	NBD-021								○	○	◎	○	◎						○	○	○											○		
	NBD-020								○	○	◎	○	○						○	○	○											○		

注意

1) 薄膜包衣（片剂）
该表中使用的术语“薄膜包衣”是指常规的水溶性聚合物包衣。
合适的添加剂可以实现特殊的特性，例如掩味，着色，避光等。

2) 掩味
根据待掩盖的味道的强度来配制包衣液。

3) 迅速崩解
溶胀剂的常规应用。

4) 快速溶出
L-HPC使片剂崩解成细小颗粒，可以提高溶出速率。

5) 干粘合剂
术语“干粘合剂”是指用作干粉末的赋形剂，用于增强片剂硬度和降低易碎性。

6) 薄膜包衣（微丸）
这种包衣避免了不利的相互作用。

7) 滴眼液
此应用可能需要特殊的属性。请与我们的销售部门联系以获取帮助。原料药GMP不适用。

据我们所知，本册所有的信息和资料是准确可靠的，但是这些数据不作为保证和担保，仅作为推荐和建议。我们基于用户会自行检测我们的产品以决定是否适合特定应用的理念来销售所有的产品。用户也应保证根据这些数据、推荐和建议来使用产品而不侵犯任何专利权，所以信越不承担类似侵权的责任。我们特此声明拒绝特殊目的的适销性或适用性进行担保。

信越化学工业株式会社

纤维素&药用辅料部

日本东京都千代田区丸之内1-4-1, 邮编100-0005

电话: 81-3-6812-2441 传真: 81-3-6812-2443

<http://www.metolose.jp/e>

Shin-Etsu Chemical Co., Ltd.

Cellulose & Pharmaceutical Excipients Department

4-1, Marunouchi 1-chome, Chiyoda-ku, Tokyo, Japan, 100-0005

Tel: 81-3-6812-2441 Fax: 81-3-6812-2443

<http://www.metolose.jp/e>

中国总代理: 大连业建贸易有限公司

辽宁省大连市沙河口区黄河路677号天兴罗斯福大厦1801室

电话: 0411-8452-1177 传真: 0411-8452-1199/2288

<http://www.dalian-diligence.com>

Chinese Distributor: Dalian Diligence Trade Co., Ltd.

Room No.1801, Tianxing Roosevelt Center, No.677 Yellow River Road, Shahekou Dist., Dalian, China.

Tel: 0411-8452-1177 Fax: 0411-8452-1199/2288

<http://www.dalian-diligence.com>
