

改良型新药口溶膜 | 服药so easy

优普惠 2022-06-17 07:30 发表于广东



口溶膜剂 (ORAL THIN FILM , OTF) , 又称口腔溶膜剂、口腔分散膜剂、口腔速溶薄膜剂、口腔速解溶膜、舌下膜、舌膜剂 , 是一种新的药物传递系统 , 是由药物与适宜的成膜材料 (多为聚合物) 经加工制成的膜状制剂 , 供口服或粘膜使用。成膜材料多为聚合物。

OTF能够快速释放药物并促使药物直接进入体循环系统 , 通过口腔或舌下吸收 , 避免药物暴露在胃肠道环境中 , 并释放出更大比例的API , 适用于多种疾病 , 如偏头痛、精神分裂、阿片类药物依赖、疼痛、恶心和呕吐。

与传统片剂、胶囊等剂型相比 , 口溶膜具有以下优势 :

- 服药无需饮水 , 适合儿童、老年人及吞咽困难患者 , 提高患者依从性
- 携带、服用方便 , 口感好
- 崩解快 , 起效快
- 经口腔粘膜直接吸收 , 避免首过效应 (first-pass effect) , 提高生物利用度
- 生产工艺简单 , 剂量灵活 , 可定制给药

随着人口老龄化和慢性疾病的高发导致越来越多吞咽困难患者出现 , 市场对OTF的需求在不断增长。根据MarketResearch Future预测全球口溶膜市场将在2018-2023年之间以10.50%的复合增长率增长。

口溶膜剂属于改良型新药 , 其市场前景已得到国内头部企业的认可和布局 , 如目前口溶膜剂批文集中在齐鲁、豪森、恒瑞三家企业中 (见图1) 。此外 , 在集采极限压价、各种成本持续上涨等压力下 , 越来越多企业投身于开发改良型新药 , 越来越多企业布局了口溶膜剂 , 这从CDE历年的受理情况中可见一斑 , 如表1所示。



国产药品

搜索结果： 国产药品

序号	批准文号	产品名称	生产单位
1	国药准字H20200012	奥氮平口溶膜	江苏豪森药业集团有限公司
2	国药准字H20210005	奥氮平口溶膜	齐鲁制药有限公司
3	国药准字H20200011	奥氮平口溶膜	江苏豪森药业集团有限公司
4	国药准字H20210004	奥氮平口溶膜	齐鲁制药有限公司
5	国药准字H20220005	他达拉非口溶膜	齐鲁制药有限公司
6	国药准字H20220004	他达拉非口溶膜	齐鲁制药有限公司
7	国药准字H20223056	昂丹司琼口溶膜	江苏恒瑞医药股份有限公司
8	国药准字H20220006	他达拉非口溶膜	齐鲁制药有限公司
9	国药准字H20223055	昂丹司琼口溶膜	江苏恒瑞医药股份有限公司
10	国药准字H20210009	孟鲁司特钠口溶膜	齐鲁制药有限公司

图1.国内口溶膜上市产品

表1.口溶膜类产品CDE受理情况

企业	CDE 受理产品	注册分类
浙江和泽医药科技股份有限公司	盐酸多奈哌齐口溶膜	2.2 类
	盐酸美金刚口溶膜	2.2 类
四川科伦药业股份有限公司	枸橼酸西地那非口溶膜	2.2 类
	昂丹司琼口腔速溶膜	3.1 类(旧分类)
四川百利药业有限责任公司	他达拉非口腔速溶膜	2.2 类
	盐酸多奈哌齐口腔速溶膜	2.2 类
	伏格列波糖口腔速溶膜	3.1 类(旧分类)
	苯拉肾素口腔速溶膜	3.2 类(旧分类)
	美芬肾素口腔速溶膜	3.2 类(旧分类)
	消旋卡多曲口腔速溶膜	5 类(旧分类)
上海现代制药股份有限公司	孟鲁司特钠口溶膜	5 类(旧分类)
齐鲁制药有限公司	阿立哌唑口溶膜	2.2 类
	利培酮口溶膜	2.2 类
	磷酸奥司他韦口溶膜	2.2 类
	盐酸美金刚口溶膜	2.2 类
	草酸艾司西酞普兰口溶膜	5 类(旧分类)
	盐酸伐地那非口溶膜	5 类(旧分类)
力品药业(厦门)股份有限公司	阿立哌唑口溶膜	2.2 类
	他达拉非口溶膜	2.2 类
	盐酸多奈哌齐口溶膜	2.2 类
江苏恒瑞医药股份有限公司;江苏豪森药业集团有限公司	他达拉非口溶膜	2.2 类
江苏恒瑞医药股份有限公司	恩替卡韦口溶膜	5 类(旧分类)
	佐米曲普坦口溶膜	5 类(旧分类)
江苏豪森药业集团有限公司	奥氮平口腔速溶膜	2.2 类
黑龙江福和華星制药集团股份有限公司	硫酸沙丁胺醇口腔速溶膜	5 类(旧分类)

卡拉胶特性及配置建议

虽然OTF剂型具有诸多优势，但在开发时有诸多挑战。如配方稳定性、患者感官体验（口感、机械强度、有效成分含量均一性等）。选择合适的辅料和确定API剂量，以确保治疗效果和良好的患者依从性，是设计一款出色口溶膜产品的关键。

CEAMSA公司生产的卡拉胶（表2）是一种从红藻中提取的具有独特功能的天然亲水凝胶，可作为软胶囊或硬胶囊的原材料、增稠剂、成膜剂使用，符合美国、欧洲药典要求，广泛应用于医药、食品和化妆品行业。

表2.卡拉胶产品

型号	应用
Ceampharma 8010	软胶囊
Ceampharma 8030	软胶囊
Ceampharma 8050	硬胶囊，口腔膜
Ceampharma 91-680	糖浆剂，混悬剂

今天为大家介绍的是可作为口溶膜剂成膜材料的Ceampharma 8050。8050是一种水溶性聚合物的成膜材料，含有8050的口溶膜在接触唾液后溶于口腔内，这确保了活性成分的快速吸收和即时生物利用度。8050可用于生产具有良好机械强度和良好口感的口溶膜剂。8050用于口溶膜时，其特性及配置建议如下所示：

产品档案

【名称】卡拉胶

【别名】角叉菜胶

【性状】白色至米色粉末

【型号】Ceampharma 8050

【生产商】CEAMSA

【标准】USP/NF，EP

【CAS号】9000-07-1

【包装规格】25kg/包

【包装材料】内聚乙烯袋和外纸袋

【有效期】 24个月

【贮存】 阴凉干燥处密封保存

【应用】 口溶膜剂、硬胶囊材料

【性能】

> 口溶膜配置建议

成分	用量%
普鲁兰多糖	49-92
丙二醇	0-17
薄荷脑	0-10
Ceampharma 8050	0.5-5
安赛蜜	0-6
三氯蔗糖	0-6
吐温 80	0.1-7
总量	100

> 配置步骤

步骤1. 将Ceampharma 8050与干燥成分进行预混合

步骤2. 将其与溶剂混合

步骤3. 混合并加热溶液/悬浮液(60-90°C)

步骤4. 脱气步骤

步骤5. 聚合物溶液/悬浮液的浇注

步骤6. 将浇注液/悬浮液在热风烘箱(40-50°C)中进行干燥

步骤7. 将制备好的薄膜进行剥离、切割、包装

样品申请

深圳市优普惠专业经营进口API&药用辅料及应用推广22年。代理的产品涵盖东辰、Budenheim、SPI、亚什兰、大丰胶囊、Vikram、CEAMSA、索尔维(Solvay)、伊士曼、沙索、卡博特、漂莱特、Berry等国际一流辅料企业品牌，三十多大类，近千个品种的高品质药用辅料、原料药、药用包材等系列产品。其中包括关键性注射级辅料和高品质口服制剂辅料等，广泛应用于片剂、胶囊剂、混悬剂和注射剂等制剂中。

欢迎关注“优普惠”公众号获取更多产品信息，众多产品和资讯总有您需要的，也可扫描下列二维码免费申请样品，赶快行动吧！



扫描二维码申请样品



优普惠

专注新型功能性药用辅料！

25篇原创内容

公众号

- ◆ 干货汇总 | SPI甘露醇系列产品及应用汇总
- ◆ 新品速递 | Ceamsa公司卡拉胶推荐

- ◆ **SPI甘露醇又添新登记号（附登记号）**
- ◆ **已激活！胶态二氧化硅登记号及应用制剂**
- ◆ **还在十二烷基硫酸钠死磕？不妨试试多库酯钠！**
- ◆ **基于无水磷酸氢钙的丸芯-制备多单元制剂的优秀选择**



点分享



点点赞



点在

喜欢此内容的人还喜欢

干货汇总 | SPI甘露醇系列产品及应用汇总

优普惠

微晶纤维素兼具黏合与崩解特性，这矛盾么？

优普惠