

脂质辅料助益含CBD药物的研发

原创 医药部 嘉法狮 昨天



大麻二酚

大麻二酚 (cannabidiol) 简称CBD，是从桑科植物大麻(Cannabis sativa L.)中提取的纯天然成分，经研究证明其在多个领域有较好的医疗作用，如：**抗癫痫、抗焦虑、镇吐。**



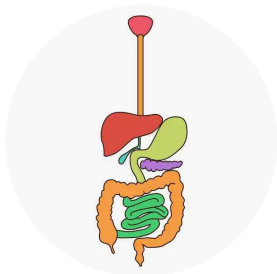
同时更为重要的是，它与另一种重要的大麻提取物-四氢大麻酚 (tetrahydrocannabinol) - 简称THC不同，CBD**不具有成瘾性**，这使得它的应用前景更为广泛。欧美上市产品中已经有诸

如Epidiolex[®]和Sativex[®]等含有CBD且浓度在100mg/mL的制剂，用于治疗多发硬化症（MS），小儿癫痫和化疗引起的呕吐、食欲降低等疾病。



首过效应较强；空腹-进食后药物生物利用度变化较大，依赖良好的处方设计。

CBD是一种亲脂性化合物，水溶性较差，必须溶解后进入胃肠道并被吸收。





目前有粉末状、树脂状、液状的原料，需要根据原料性状不同设计不同的剂型。

对光较敏感，受温度和空气影响，易被氧化。



处方设计充满挑战！！！！

嘉法狮作为全球领先的脂质辅料生产企业，在CBD制剂的开发中有诸多辅料可供客户选择，最终能获得稳定性高，吸收良好的滴剂、喷雾剂、片剂、乳膏、凝胶和栓剂等产品。

CBD 在嘉法狮脂质辅料中的溶解度**易溶****100 – 500 mg/mL**

Gelucire® 44/14

Gelucire® 48/16

Gelucire® 50/13

Labrafac™ Lipophile WL 1349

Labrafil® M 1944 CS

Lauroglycol™ FCC

Maisine® CC

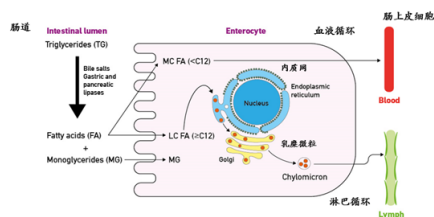
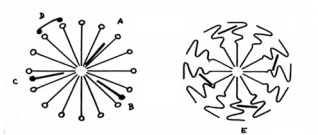
Peceol™

Plurol® Oleique CC 497

Suppocire® AM

CBD 在嘉法狮脂质辅料中的溶解度
<p>极易溶</p> <p>> 500 mg/mL</p>
<p>Capryol® PGMC</p> <p>Capryol® 90</p> <p>Geleol™ mono and diglycerides NF</p> <p>Labrafac™ PG</p> <p>Labrasol® ALF</p> <p>Lauroglycol™ 90</p> <p>Transcutol® HP</p>

我们提供的辅料可以最大化的提高CBD的溶解度，保证在不同剂型中的载药量，而我们的脂质处方可以最大程度提高CBD的口服生物利用度，是因为：



脂质处方的优势

脂质处方可以溶解CBD并维持其在胃肠道的溶解状态，保证药物吸收的稳定。

长链脂肪酸甘油酯可以**提高淋巴转运以降低药物的首过效应，提高生物利用度。**

该类处方可以**降低进食对药物吸收带来的影响。**



嘉法狮可以提供不同类型的脂质处方给客户，根据最终剂型的不同从简单的油相处方到自乳化系统(SEDDS)，我们都有**高效并合规**的辅料供客户选择。



我们推荐使用单亚油酸甘油酯**Maisine® CC**进行CBD油性制剂的开发，因为该辅料拥有诸多特点：

1

作为甘油酯类产品，对亲脂的**CBD增溶**效果明显。

2

含有长链不饱和脂肪酸-亚油酸（C18:2），能够**促进淋巴吸收**，极大的规避了肝脏的首过效应，提高CBD在体内的**生物利用度**。

3

来源于天然玉米油，**具有与玉米油类似的醇香口感**，便于患者服用。

嘉法狮是全球脂质辅料和脂质技术的革新者和领导者，在全球CBD药用热潮之下，使用我们的脂质产品和处方必定能够帮助国内制剂企业加速CBD在治疗领域的应用。