

【分享】聚克立林在口服制剂中的应用

优普惠 2022-06-24 07:30 发表于广东



英国漂莱特（Purolite）集团成立于1981年，是目前世界上规模前几的离子交换树脂生产、研发和市场开拓的专业跨国集团公司。集团现共有四个生产基地，分别设在英国、美国、罗马尼亚及中国，拥有500多种产品，年生产离子交换树脂6万余吨。

漂莱特生产的离子交换树脂（见表1）是一种遇水溶胀，不溶于水的高分子聚合物，由功能团和非活性基团构成。在药物制剂中用作活性药物成分（API）或赋形剂。符合USP、Ph.Eur、BP和JP的要求，主要用于医药、食品、水处理、环保、化工、生命科学等领域。

表1.离子交换树脂产品

型号	DMF	登记号	特性
聚克立林钾 (原波拉克林钾) C115KMR/5100	7940	F20210000083	离子交换容量 10eq/kg，粒径 75-150μm，弱酸型，超级崩解剂，掩味、缓释材料。
聚克立林 C115H MR	/	/	离子交换容量 10eq/kg，弱酸型
消胆胺 A430 MR	7324	/	强碱阴离子交换树脂，原料药
聚苯乙烯磺酸钠 C100NaMRNS	5882	/	K ⁺ 交换容量 2.8-3.4meq/g，强酸型，掩味剂，用于缓控释，原料药
聚苯乙烯磺酸钙 C100CaMRNS	/	/	K ⁺ 交换容量 1.3-2meq/g，强酸型，原料药

今天为大家介绍的是可作为掩味剂、药物稳定剂、阳离子药物载体的产品聚克立林C115H MR。

C115H MR是一种不溶性H型弱酸性（-COOH）阳离子交换树脂粉末。其特殊的化学结构赋予了其卓越的性能和无毒的特性。极弱酸性的羧基（pK_{Na}= 5.5-6.0）使其非常适合吸收许多复杂的碱，包括呈碱性的药物，这有助于分离、纯化、加载这些化合物，并在应用时缓慢释放。C115H MR是流动性优异的粉末，总水分含量低。经过特殊处理可包含少

量萃取物。当按照 FDA 推荐的方式应用此类产品时，这些特性使其成为制药行业的理想选择。

产品档案

【名称】聚克立林

【型号】C115H MR

【性状】灰白色粉末

【生厂商】Purolite 漂莱特

【CAS号】50602-21-6

【标准】USP/NF, EP

【聚合物】与二乙烯基苯交联的聚甲基丙烯酸酯

【离子形态】H⁺形式

【官能团】羧酸

【中值粒径】<150 μm

【包装规格】25kg/桶

【有效期】60个月

【贮存】密闭，于阴凉干燥处贮藏

【应用】掩味剂、药物稳定剂、阳离子药物载体

【结构】

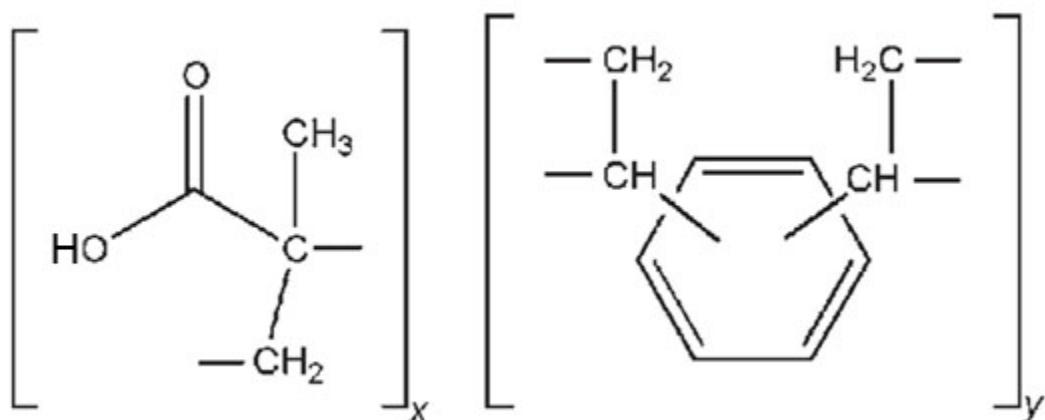


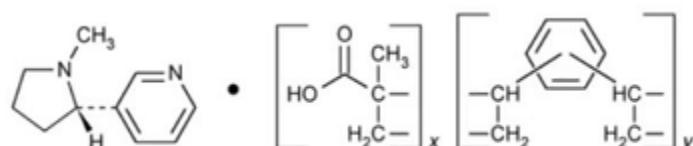
图1.聚克立林结构

【功能用途】

- 不溶性弱酸型（ $-COOH$ ）阳离子交换树脂，为干燥细微颗粒，主要作为碱性药物的载体。可以掩盖药物的味道，防潮解，提高不稳定药物的稳定性；
- 当暴露在体内酸性环境（胃）中，聚克立林与氢离子的高亲和性会导致被吸附药物的快速解吸附（0.1 NHCl中15 min溶出大于85%），达到快速释药的目的；
- 与强酸性离子交换树脂（聚苯乙烯磺酸钠/钙）相比，聚克立林具有更高的解吸附效率。

案例分析

尼古丁口香糖



- 尼古丁为低熔点液态药物（ -79°C ）；
- C115H MR+尼古丁树脂盐是非熔融固体形态（等同于固态盐）；
- C115H MR可将低熔点或液态药物制成固体口服制剂。

Nicotine Polacrilex树脂盐：

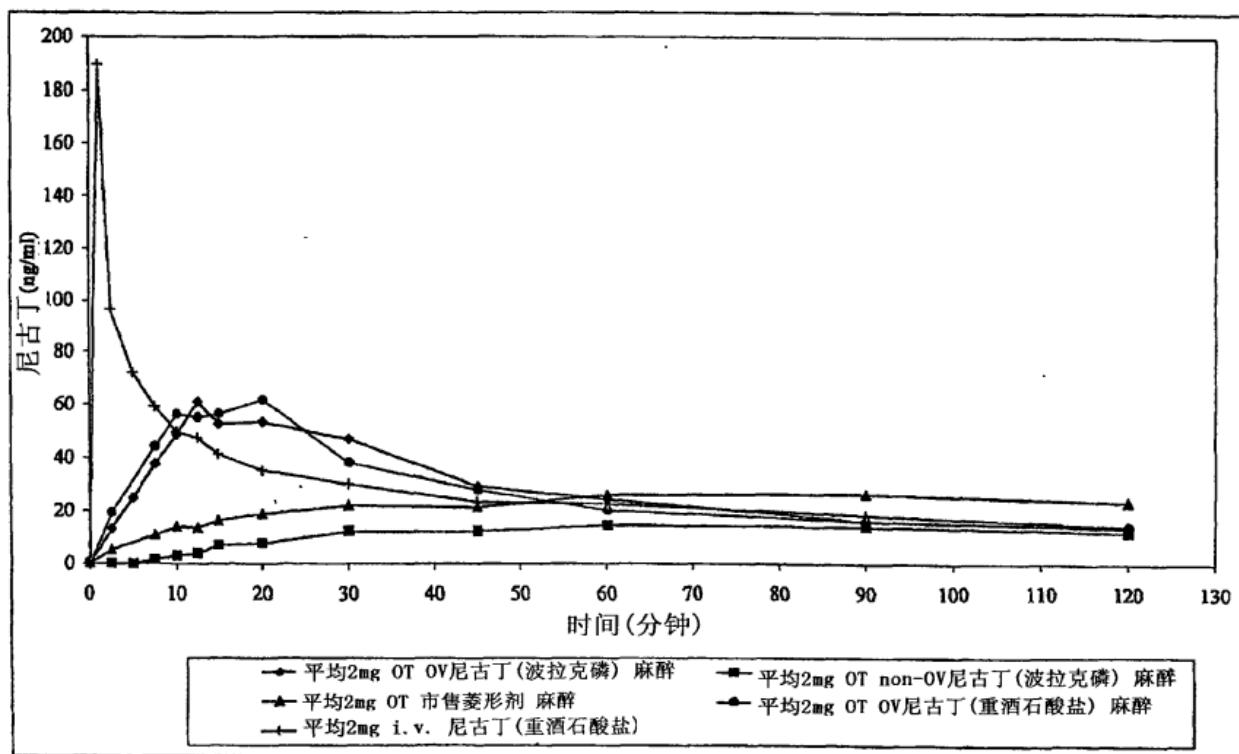
氯化钠溶液中10min释放70%以上，水溶液中30min释放小于5%，掩味效果良好。

Nicotine Polacrilex口含片、咀嚼片：

pH7.4磷酸盐缓冲液释放数据如下：

时间 (h)	1	2	3	4	5	6	7	8
累积释放度 (%)	34	50	63	75	84	91	96	99

结论：C115H MR+尼古丁形成的树脂盐制备口含片、咀嚼片等缓释制剂，其累积释放度比较缓慢，5小时释放84%。



结论：无论是制成口含片还是咀嚼片等口服制剂，都可以保持稳定的血药浓度，缓释效果良好。

氢溴酸右美沙芬口腔分散膜剂

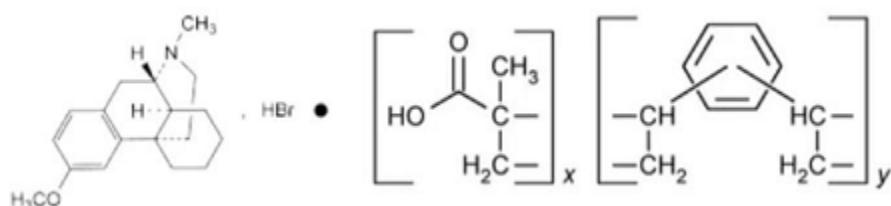


表2.处方

辅料名称	作用	厂家
聚克立林 C115H MR	掩味剂	漂莱特
微晶纤维素	填充剂	东辰制药
羟丙甲纤维素	成膜材料	亚什兰
羧甲纤维素钠		
丙二醇	增塑剂	/
聚乙二醇	保湿剂	沙索
三氯蔗糖	甜味剂	/
香精	矫味剂	/

结论：做成膜剂后可以改善口感，无苦味、不麻舌；崩解时限 < 30S，在盐酸中溶出度15分钟大于85%，到胃里可以达到一个快速释放的目的。

应用举例

尼古丁	右美沙芬
帕罗西汀	索利那新
去氧肾上腺素	文拉法辛
奥昔布宁	二甲双胍
维生素B12	

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



YUHUIPU
YUHUIPU



点分享



点点赞 点在看

喜欢此内容的人还喜欢

近期日常

梁伟峰



【能力作风建设年】跟我学-39

呼玛县人民检察院



7.419分，最快1个月接受，年发文1560多篇！

邂逅SCI

