

# 肠溶包衣材料-纤维醋法酯C-A-P

优普惠 2022-08-05 08:07 发表于广东



美国伊士曼Eastman生产的纤维醋法酯C-A-P肠溶包衣材料是一种pH敏感的纤维素衍生物，分为粉末和颗粒两种形式，可用于片剂和颗粒剂的肠溶包衣。

C-A-P肠溶包衣材料可耐受与酸性胃液长期接触，但在小肠的弱酸性至中性环境中容易溶解。它可以和有机溶剂制成溶液，用于片剂或颗粒剂包衣，从而实现药物的肠溶和延迟释放，也可以用作保护性/掩味包衣，防止药物在酸性胃环境中释放。

## 产品档案

【名称】纤维醋法酯

【曾用名】醋酸邻苯二甲酸纤维素

【型号】Eastman™ C-A-P

【性状】白色或类白色的颗粒或粉末

【生厂商】伊士曼Eastman

【CAS号】9004-38-0

【标准】NF、EP、JP

【包装规格】50kg/桶

【复验期】24个月

【贮存】遮光，密闭保存。C-A-P应密封在配备聚乙烯内衬和可重复使用的金属封盖的防潮纤维桶中。如存放在阴凉干燥处，在打开前应先恢复到室温，以防止内表面出现凝结的水珠。在高温或高湿条件下长时间存放，C-A-P会缓慢水解，增加游离酸含量，所以长时间储存后，应检验乙酰基、邻苯二甲酸和游离酸是否符合质量标准要求

【应用】肠溶包衣材料、释放阻滞剂

【结构】

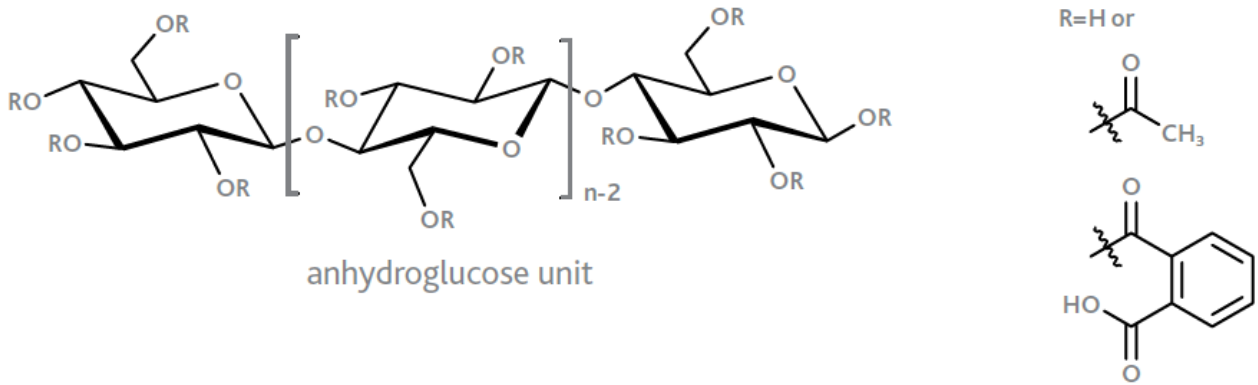


图1.C-A-P结构式

【性能】

表1.C-A-P性能

Table 1. Typical properties<sup>a</sup>

Physical form	White powder or pellets <sup>b</sup>
Composition	
Phthalyl, %	30.0–36.0
Acetyl, %	21.5–26.0
Moisture, %	< 5.0 wt%
Free acid (as phthalic acid), %	< 3.0 wt%
Viscosity, <sup>c</sup> cP at 25°C	45–90
pH solubility in USP buffer solutions	≥ 6.2

<sup>a</sup> Properties reported here are typical of average lots. Eastman makes no representation that the material in any shipment will conform exactly to the value listed. Specifications are available on request.

<sup>b</sup> Pelletized C-A-P exhibits slower dissolution time in poor solvents such as ethyl acetate/isopropanol blends. Acetone or acetone blends are the preferred solvents for C-A-P pellets.

<sup>c</sup> Centipoises, 15% C-A-P in an acetone solution

【有机溶剂体系】

表2.可用于溶解C-A-P的有机溶剂

**Table 2. Organic solvent systems**

The following solvent systems can be used to dissolve Eastman C-A-P.

System	C-A-P
Acetone	100
Acetone:ethyl alcohol	50:50
Acetone:isopropyl alcohol	50:50
Acetone:methyl alcohol	50:50/25:75
Acetone:methylene chloride	50:50/25:75
Methylene chloride:ethyl alcohol	75:25
Ethyl acetate:ethyl alcohol	50:50
Ethyl acetate:isopropyl alcohol	50:50/75:25
Ethyl alcohol:water	—

*Note: In using acetone blends, it is important to dissolve the powder in acetone before adding the second solvent.*

增加酒精含量或水含量会改变C-A-P在溶剂体系中的溶解度，并可能延缓干燥速度。为了在有机溶剂中快速溶解并防止凝胶形成，在制备包衣溶液时，应在搅拌的同时将C-A-P缓慢地加入到混合溶剂中，并在使用前将包衣液进行过滤。

## 案例分析

### ★ 阿司匹林颗粒C-A-P包衣

用C-A-P肠溶聚合物制备的包衣液，性能可以在包衣前加入增塑剂来改善。增塑剂增加了包衣的韧性（提高了对碎裂或开裂的抵抗力），同时降低了包衣的玻璃化转变温度（ $T_g$ ）。一般来说，增塑剂的最佳浓度是为形成连续涂层提供必要的柔韧性的最小量。

C-A-P常用的增塑剂有聚乙二醇（PEG）、甘油三乙酸酯、邻苯二甲酸二乙酯和柠檬酸三乙酯（TEC）。所用增塑剂的量可高达包衣重量的35%。

## 材料及方法

使用Glatt GPCG-5流化床喷雾器对阿司匹林颗粒进行C-A-P包衣。包衣溶液由7.5% C-A-P、2.5%甘油三乙酸酯和90%丙酮组成，并在使用前过滤。阿司匹林颗粒的包衣增重为7.5%。

通过USP溶出度试验评估阿司匹林颗粒的肠溶特性，见图2。把阿司匹林颗粒在室温下储存1天和储存6个月后进行测试。

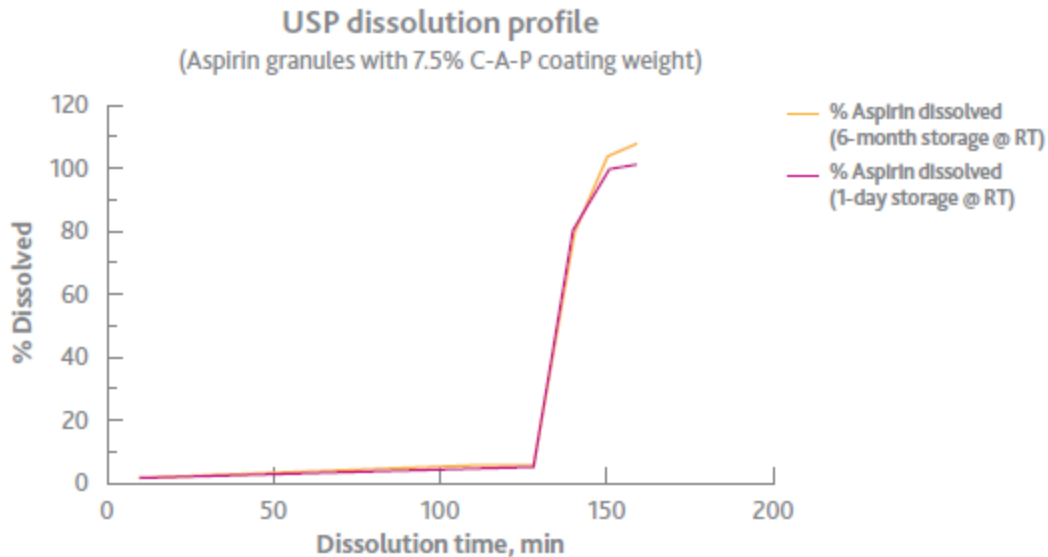


图2.C-A-P包衣的阿司匹林颗粒的溶出曲线比较

▶▶▶ 上图可以看出，使用C-A-P进行包衣的阿司匹林颗粒在室温下储存6个月和在室温下储存1天的溶出曲线没有显著变化。

## 总结

- 纤维醋法酯C-A-P可用于肠溶包衣，保护药物不受胃液影响，可实现药物的肠溶和延迟释放效果；
- 用C-A-P包衣后，可使产品在室温下常时间储存时，保持稳定的质量和始终如一的释放效果；
- C-A-P可溶于丙酮、丙酮与乙醇混合物、异丙醇与乙酸乙酯混合物等有机溶剂，用于片剂及颗粒剂包衣，防止药物在酸性胃环境中释放；

- C-A-P包衣液中加入增塑剂（聚乙二醇、柠檬酸三乙酯等）可增加包衣膜的韧性，同时降低包衣的玻璃化转变温度（ $T_g$ ）。

## 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，也可扫描下方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

- ◆ 第七批集采中标企业“惨胜”，价格趋近成本？（文末附大福利）
- ◆ 流动性差API-解决直压难题
- ◆ 网红雪糕刺客中添加的“卡拉胶”-安全吗？
- ◆ 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！



点分享



点点赞



点在看

喜欢此内容的人还喜欢

一场全新实验，一份共创人生清单  
午夜飞行



【能力作风建设年】跟我学-39  
呼玛县人民检察院



得不到的再骚动，也要尽量冷静  
小宛子

