



经验证的缓释问题解决方案

Eastman **BIO-SUSTANE™ SAIB NF**
pharmaceutical excipient

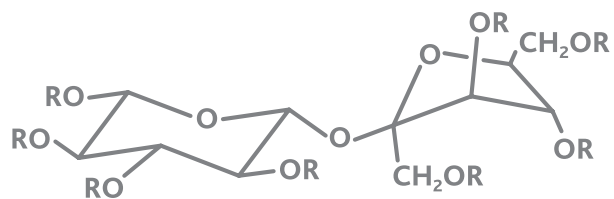
EASTMAN

药物配方生产商都知道, 选择正确的赋形剂是药物开发过程中的一个关键决策程序。

采用 Eastman BioSustane™ SAIB NF, 可以令这个决策程序变得简单。这是一个多用途解决方案, 可用于应对难溶性、延缓释放、贮库成型和滥用威慑等难题。这款创新的赋形剂具有多种功能, 并已在一款 FDA 批准的药物配方中使用。

BioSustane 是一种安全的天然产品, 由素以高质量标准而闻名的 Eastman 在符合现行良好生产规范 (CGMP) 的设施中制造而成。

化学结构



BioSustane (乙酸异丁酸蔗糖酯)

R = 乙酰基、异丁基或 H

CAS 126-13-6

产品特性

BioSustane 是乙酸异丁酸蔗糖酯, 一种具有以下属性的酯化糖衍生物:

- 无味、无色、粘稠的液体
- 使用常用的药用溶剂可以大幅降低粘度。
- 不会结晶, 在环境温度下保持非晶态
- 非聚合物; 与含水体液接触时不会凝结或沉淀
- 可溶于有机溶剂, 借助有机溶剂和表面活性剂可分散于水中
- 具有生物粘附特性和粘膜粘附特性
- 热稳定、水解稳定且氧化稳定

监管状况

BioSustane SAIB NF 均根据国际药用辅料理事会规定的现行良好生产规范 (CGMP) 在专用设施中制造而成, 现已有一篇专论收录于美国药典国家处方集 (USP-NF), 并被美国 FDA 评定为公认安全 (GRAS) 产品。

DMF 19694 已在 FDA 备案。



市售产品

BioSustane 目前已通过多种制剂上市, 其中包括:

- **Posimir**: 一款注射用布比卡因药物, 于 2021 年 2 月获得 FDA 批准*
- **Methydur** 缓释胶囊: 一款用于治疗注意力缺乏/多动症 (ADHD) 的药物制剂, 于 2018 年 9 月获准在台湾上市
- **SucroMate™**: 一款经 FDA 批准的动物保健产品

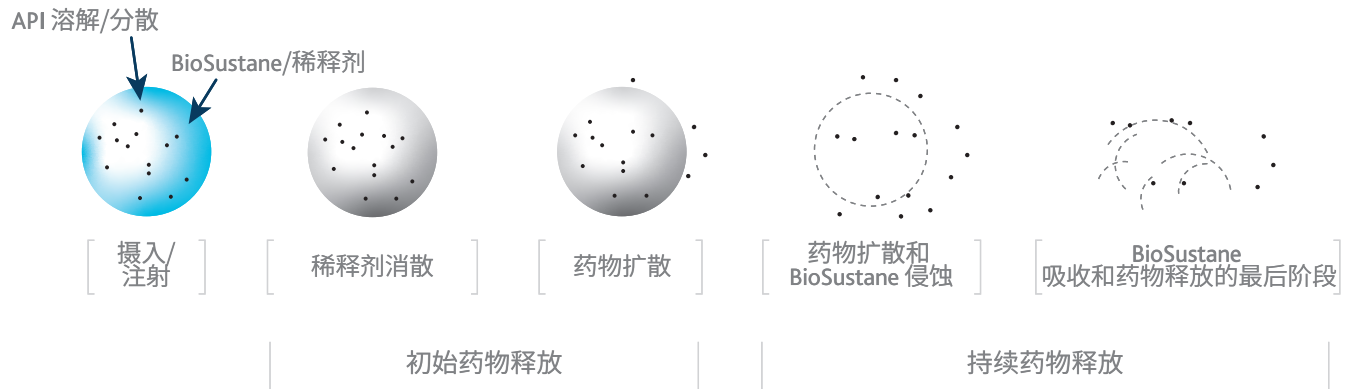
BioSustane 可实现制剂的延缓释放。

BioSustane 的高亲脂性使其成为口服缓释制剂和注射用贮库制剂的理想选择。无论是口服给药还是注射给药, 当暴露于水性环境中时, BioSustane 可形成凝胶状基质贮库, 将有效成分锁在其中。活性成分会随时间缓慢释放。

从 BioSustane 中延缓释放原料药的机制

概念: 在注射含有 BioSustane、溶剂、原料药和可选添加剂的溶液时, 少量溶剂扩散到周围组织或间质液中, 留下一个高粘度的贮库, 它能让活性成分的释放得以延缓。通过添加可生物降解聚合物等添加剂, 可以减缓贮库的分解速度。

从 BioSustane 贮库释放 API 的机制



BioSustane 用于注射剂的优势

- 简单制剂 - 成分可低至三种
- 没有复杂的加工程序 - 例如: 无需微球体
- 可控释放速率 - 72 小时至 6 周
- 与溶剂和原料药具有较强的相容性

Eastman 不销售可注射级别的 BioSustane。

*POSIMIR 是 Innocoll Pharmaceuticals Limited 在美国的商标, 在美国以外则是 DURECT Corporation 的商标。

BioSustane 在 已获 FDA 批准的注射药物 Posimir 中的应用

- **Posimir**

Posimir 是一种适用于成人治疗的布比卡因溶液,用于在关节镜下直接可视化注入肩峰下间隙,可在关节镜肩峰下间隙减压术后产生最多 72 小时的术后镇痛作用。

- **BioSustane 在制剂中的应用**

BioSustane 作为贮库成型剂基质,可使布比卡因实现 72 小时的稳定释放。

- **上市情况**

Posimir 已获准在美国上市,并随后取得 Innocoll Biotherapeutics 的商业化许可。

可能的 Posimir 配方

成分	专利声明	实际注射溶液*
布比卡因(游离碱)	5–20 wt%	132 mg/mL
BioSustane	25–75 wt%	725 mg/mL
苯甲醇	10–55 wt%	220 mg/mL

局部麻醉剂,用于 72 小时内的疼痛控制

*布比卡因最大剂量 = 660 mg, 5 mL 溶液, 单次注射

资料来源: <https://pdfpiw.uspto.gov/>, [Posimir.com](https://www.posimir.com/), [Innocoll.com](https://www.innocoll.com/), 美国食品药品监督管理局和 Eastman 研究资料

BioSustane 在获得 FDA 批准的兽药 SucroMate 中的应用

- **SucroMate**

SucroMate Equine (醋酸德舍瑞林) 是一种无菌合成促性腺激素释放激素 (GnRH) 类的悬浮液。

SucroMate Equine 是一款缓释制剂,在肌肉注射后形成原位凝胶。

- **BioSustane 在制剂中的应用**

BioSustane 作为贮库成型剂,可使醋酸德舍瑞林实现约 48 小时的稳定释放。

- **上市情况**

SucroMate 已获准在美国销售。

SucroMate 配方

成分	金额
醋酸德舍瑞林	1.8 mg
BioSustane SAIB	700 mg
碳酸丙烯酯	300 mg

资料来源: <https://thornbioscience.com/veterinary-products/>, <https://www.orbit.com/#PatentDocumentPage>



正在开发中的贮库

42 天释放期的探索性眼用制剂

成分	专利声明	具体实例
西罗莫司	1-5 wt%	3 wt%
BioSustane	0.5-5 wt%	1 wt%
苯甲酸苄酯	35-45 wt%	43.6 wt%
乙醇	3-10 wt%	4.8 wt%
聚乙二醇	40-50 wt%	45 wt%
维生素 E	0.5-2 wt%	1 wt%

资料来源:美国专利 20200383957

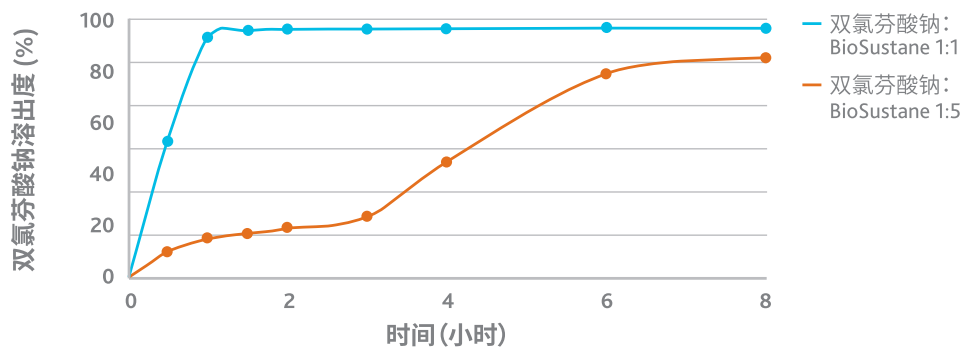
21 天释放期的探索性兽用制剂

成分	专利声明	具体实例
制药原料药	未给定	15 wt% (氟苯尼考)
甘油三酯载体	5-70 wt%	44 wt% (三醋酸甘油酯)
BioSustane	5-70 wt%	37 wt%
溶剂	30-60 wt%	4 wt% (乙醇)

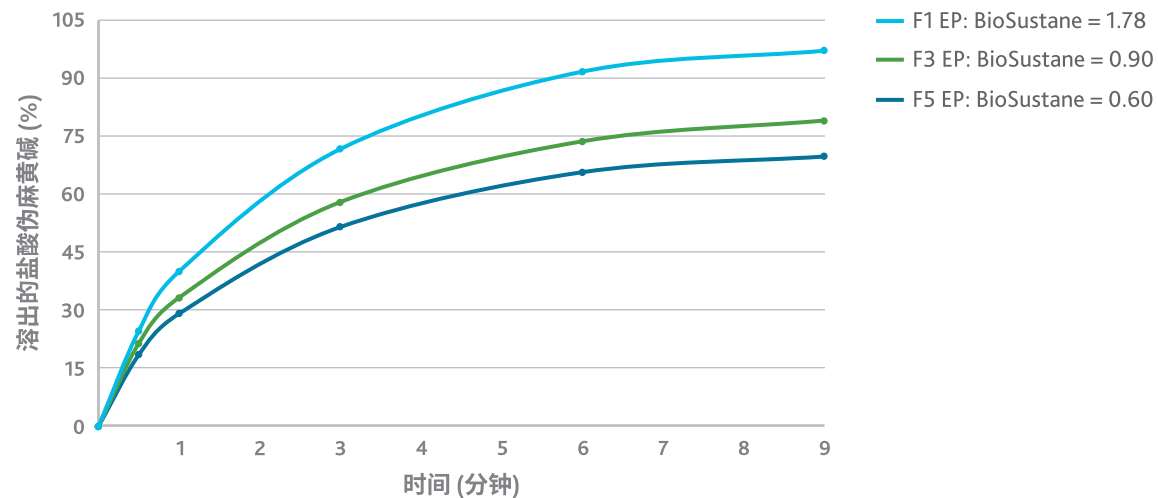
资料来源:美国专利 20200368263

缓释口服制剂展示了制剂中的不同 BioSustane 含量对释放速率会产生怎样的调节效果。

双氯芬酸钠在不同 BioSustane 含量下的延缓释放



基于聚氧化乙烯 (49.8% 64%) 和 BioSustane (71% 24.3%)
的盐酸伪麻黄碱基质片剂的延缓释放。



总结

BioSustane 是一种具有多种功能的赋形剂,可帮助药物配方生产商找到解决配方挑战的新途径。

欢迎访问 Eastman.com/pharma, 进一步了解 BioSustane 可为您的配方需求提供哪些支持, 或与专家进行交流。





注解

EASTMAN

Eastman公司总部

P.O. Box 431
Kingsport, TN 37662-5280 U.S.A.

美国和加拿大, 800-EASTMAN (800-327-8626)
其他位置, + (1) 423-229-2000

eastman.com/locations

虽然本文中阐述的信息和建议出于诚意提供,但是Eastman Chemical Company (“Eastman”)及其子公司对其完整性或准确性不作任何声明或保证。您必须自行确定其对于您的自用、环境保护、您的员工及产品购买者的健康与安全的适用性和完整性。本文中包含的任何内容均不构成对使用任何产品、流程、设备或与任何专利冲突的配方所提出的建议,并且我们不对相关使用不会侵犯任何专利做出任何明示或暗示的声明或保证。此处对于信息或信息所指代的产品不做任何关于适销性、适用于某特定用途或任何其他性质的明示或暗示的声明或保证,并且本文中的任何内容均不会放弃卖方的任何销售条件。

可在线获取,也可通过申请获取规定了处理和存放我们的产品时应遵守的安全预防措施的安全数据表。在处理我们的产品之前,您应获取并审阅可用的材料安全信息。如果提及的任何材料并非我们的产品,则应遵守其制造商建议的适当工业卫生和其他安全防护措施。

© 2023 Eastman。本文中引用的Eastman品牌是Eastman或其子公司之一的商标或根据授权使用。本文中引用的非Eastman品牌是其各自所有者拥有的商标。