

克服膳食补充剂配方挑战——维生素C

膳食补充剂配方

直压型膳食补充剂由于活性成分比例较高而理化性质较差，因此其配方可能具有一定的挑战。典型的挑战包括：

- ✓ 对环境湿、热和光较为敏感
- ✓ 较差的流动性和可压性
- ✓ 单一剂型中活性成分之间可能相互作用
- ✓ 气味较强或味道苦涩

有鉴于此，配方研究人员必须掌握活性成分的特性，选择能够改善配方属性的合适辅料，从而保证最终剂型的成功制备以及保质期内的稳定性。

湿法制粒



干法制粒



用善捷的直压工艺



薄膜包衣

挑战

维生素C(抗坏血酸)是一种得到广泛应用的促进免疫系统的膳食补充剂¹。使用剂量范围广泛，并且极易溶于水。但是较差的流动性和可压性给配方和制造工艺带来一定的挑战。同时，维生素C对水分敏感，在储存过程中容易发生降解。本项研究旨在证明直压型淀粉善捷能够简化配方和制造工艺，从而制备出稳定的薄膜包衣的维生素C片。

材料和方法

在本项案例研究中，采用直接压片工艺(表1)制备稳健的薄膜包衣的维生素C速释片(200mg剂量)。

将配方中主要成分混合10分钟，然后加入润滑剂再混合3分钟来制备1kg批次的配方混合粉末(表1)。使用13/32英寸(10.3mm)标准圆弧形B型冲进行压片，施加23kN的主压力。然后在12英寸打孔包衣锅(O'Hara Labcoat II)中，使用棕色高性能薄膜包衣系统纽特斐™(Nutrafinish®)包衣。包衣增重4%(w/w)。包衣参数如表2所示。

表1: 维生素C速释片的组成

片芯组成	% w/w	mg/片
维生素C (抗坏血酸)	50.00	200.00
善捷	24.75	99.00
微晶纤维素(90µm)	24.75	99.00
硬脂酸镁	0.50	2.00
片重总计	100.00	400.00

表2: 薄膜包衣工艺参数

包衣系统	棕色纽特斐
固含量(% w/w)	25
包衣锅转速(rpm)	13
风量(CFM)	125-142
雾化气压(psi)	20
扇面气压(psi)	20
喷液速率(g/min)	8-9
进气温度(°C)	58-60
排气温度(°C)	38-40
产品温度(°C)	32-40

结果

利用善捷能够改善维生素C的粉末性能，使配方适用于直接压片(表3)。使用含善捷的配方压片易于成形，能够制备出具有良好物理属性的完美片剂。未包衣和包衣的维生素C片的最终片剂性质如表4所示。使用薄膜包衣成功包衣后的片芯光滑且有光泽(图1)。所有片剂均在不到30分钟的时间内完全崩解，符合美国药典标准²的规定。此外，包衣片溶出度测试的结果显示在10分钟内维生素C的药物释放达90%以上(图2)。

表 3: 粉末性能比较

性能	维生素 C	配方混合物
堆密度(g/mL)	0.81	0.63
可压性指数(%)	32.00	23.23
粒度 d(0,5)(µm)	154.36	111.63
流速(g/min)	没有流动(30mm)	36.7(4mm)
整体流动性	极差	易流动

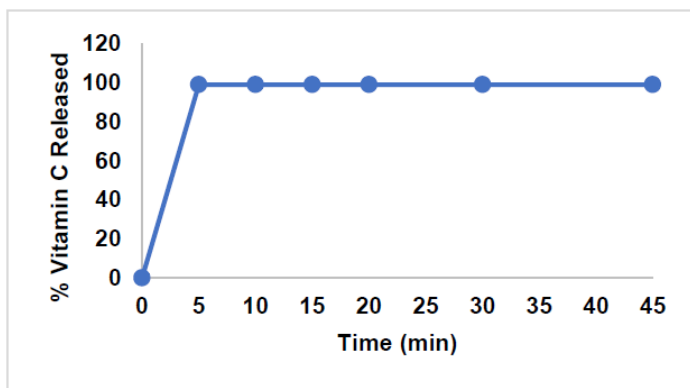
表 4: 维生素C速释片的性能

性能	未包衣片	包衣片
重量(mg)	401.51 ± 1.86	423.50 ± 2.40
厚度(mm)	5.17 ± 0.03	5.21 ± 0.03
硬度(kP)	11.90 ± 2.07	11.20 ± 1.10
脆碎度(%)	0.0 ± 0.0	0.0 ± 0.0
崩解时间(min)	1.23 ± 0.20	1.42 ± 0.12

图 1: 薄膜包衣的维生素C片



图 2: 维生素C薄膜包衣片的药物释放



结论

在维生素片C配方中使用直压型淀粉善捷能够简化配方和工艺。善捷能够提高配方粉末流动性和可压性。使用善捷可生产出性能稳健的片剂，使用高性能薄膜包衣系统纽特斐包衣可轻松获得完美的片剂外观。

善捷可克服流动性差和可压性差的配方挑战

善捷可为流动性较差的吸湿成分直接压片的稳健配方的开发提供帮助。

直接压片，“捷”尽所能

- 减少片剂配方中助流剂和超级崩解剂的使用
- 卓越的粉末流动性和混合均匀性
- 极佳的可压性和快速崩解性能
- 简化配方和工艺

参考文献

1. Zelman, Kathleen. (2010). The Benefits of Vitamin C. <https://www.webmd.com/diet/features/the-benefits-of-vitamin-c#1>
2. USP 32 – Dietary Supplements I <2020> Disintegration and Dissolution of Dietary Supplements

根据我司所知及所信，本文包含的信息真实、准确，但由于方法、条件以及产品设备的差异，故不对产品任何推荐的数据或者建议提供明示或暗示性担保。在贵方的任何用途上，也不作同样的产品适用性担保。我司对意外的利润损失、特殊或相应的损失或损害不承担责任。

卡乐康公司不作任何明示或暗示性担保。即不担保客户在应用卡乐康产品的过程中不会侵犯任何第三方或实体持有的任何商标、商品名称、版权、专利或其他权利。

更多信息请与卡乐康中国联系，电话:+86-21-61982300/4001009611-传真:+86-21-54422229

www.colorcon.com.cn · marketing_cn@colorcon.com

北美
+1-215-699-7733

欧洲/中东/非洲
+44- (0) -1322-293000

拉丁美洲
+54-11-5556-7700

印度
+91-832-6727373

中国
+86-21-61982300



© BPSI Holdings LLC, 2020.
本文所包含信息归卡乐康所有，未经许可不得使用。

* 除了特别指出外，所有商标均属BPSI公司所有

ads_2020_StarTab_vitC_CHN