

克服膳食补充剂配方挑战——咖啡因

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。常见的挑战包括：

- ✓ 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

在膳食补充剂中，咖啡因作为一种刺激剂能够提高机敏性以及帮助解决嗜睡问题¹。但是，由于其流动性和可压性较差，而且味道苦涩，因此这种成分的配方开发存在一定的障碍。本项研究表明，直压型淀粉善捷™ (StarTab™) 能够用来简化配方和制造工艺，从而制备出稳健的咖啡因薄膜包衣片。

材料和方法

在本项研究中，研制一种稳健的咖啡因薄膜包衣速释片(100mg剂量)(表1)。比例1:1的善捷和微晶纤维素(Avicel 102, Dupont)作为填充剂，帮助改善咖啡因的可压性和流动性。

首先使用12目筛去除咖啡因结块，然后通过40目筛与善捷一起过筛，混合10分钟。然后加入润滑剂(使用60目筛预先筛分)，再混合3分钟，制备1kg批次的配方见表1。

使用13/32英寸(10.3mm)标准圆弧形B型冲压片，首先施加0.5kN的预压力，然后施加15kN的主压力压片。使用白色高性能薄膜包衣系统纽特斐™ (Nutrafinish®) 在打孔包衣锅(O'Hara Labcoat II)中进行包衣，至3%增重(w/w)。包衣参数如表2所示。

表 1: 咖啡因速释片的组成

片芯组成	% w/w	mg/片
咖啡因	25.00	100.00
善捷	37.25	149.00
微晶纤维素 (90µm)	37.25	149.00
硬脂酸镁	0.50	2.00
片剂重量	100.00	400.00

表 2: 薄膜包衣工艺参数

包衣系统	白色纽特斐
固含量 (% w/w)	25
包衣锅转速 (rpm)	18
风量 (CFM)	130
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)	50
排气温度 (°C)	37-41
产品温度 (°C)	38-46

结果

咖啡因由于粒径较小导致其流动性极差。善捷能够改善配方混合粉末的流动性，并表现出一致的混合均匀性(表3)。该配方在压片后没有出现任何片芯问题，制备出具有较好物理属性，适用于薄膜包衣的良好片剂。咖啡因片的硬度和崩解时间如表4所示。成功薄膜包衣的片剂(图1)展现出诸多优点，例如提高片剂的硬度(表4)，并可掩盖咖啡因苦味。咖啡因包衣片在不到10分钟的时间内可释放80%以上的药物，药物释放呈非pH依赖型(图2)。

表 3: 粉末性能比较

性能	咖啡因	配方混合物
堆密度 (g/mL)	0.32	0.48
可压性指数 (%)	30.00	25.70
粒度 d (0,5) (µm)	8.27	85.70
整体流动性	极差	易流动

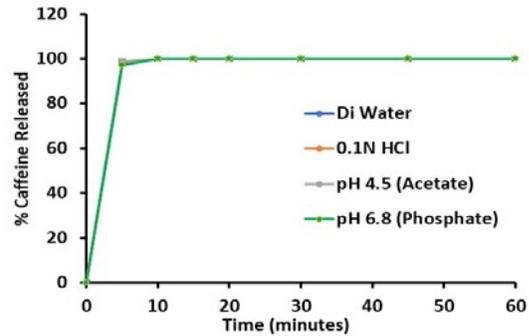
表 4: 咖啡因速释片的性能

性能	未包衣片剂	包衣片剂
重量 (mg)	399.3 ± 5.4	406.1 ± 5.6
厚度 (mm)	4.65 ± 0.02	4.69 ± 0.02
硬度 (kP)	22.5 ± 2.9	24.1 ± 2.1
脆碎度 (%)	0.0 ± 0.0	0.0 ± 0.0
崩解时间 (min)	0.68 ± 0.20	1.24 ± 0.37

图 1: 薄膜包衣的咖啡因片



图 2: 咖啡因包衣片的非pH-依赖型药物释放



结论

在咖啡因速释片配方中使用直压型淀粉善捷能够简化配方和工艺。善捷能够提高配方混合粉末的流动性和可压性。使用善捷开发的片剂性能稳定，使用高性能薄膜包衣系统纽特斐包衣可轻松获得外观完美的片剂。

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. Center for Food Safety and Applied Nutrition. (2017). What You Need to Know About Dietary Supplements. <https://www.fda.gov/food/buy-store-serve-safe-food/what-you-need-know-about-dietary-supplements>
2. Leonard, Jayne. (2019). What to Know About Caffeine Pills. <https://www.medicalnewstoday.com/articles/326822#sideeffects-and-risks>

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_caffeine_CHN