

克服膳食补充剂配方挑战——缬草根提取物

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

缬草根提取物是一种常用的治疗焦虑症和失眠症的膳食补充剂¹。它具有吸湿性，水不溶性以及极差的流动性，导致在大剂量使用时会面临巨大的压片挑战。同时，根据提取物粉末的来源，缬草根提取物还可能带有一种让人感到不愉快的气味。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缬草根提取物片剂。

材料和方法

使用直压工艺(表1和2)开发出稳健的缬草根提取物薄膜包衣速释片(300mg剂量)。使用比例为2:1的善捷和微晶纤维素作为填充剂。

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型冲压片，施加10kN的主压力。然后在12英寸打孔包衣锅(O'Hara Labcoat II)中，使用蓝色高性能薄膜包衣系统纽特斐™(Nutrafinish®)对片芯进行包衣，包衣增重3%(w/w)。包衣参数如表2所示。

表 1: 缬草根提取物速释片的组成

片芯组成	% w/w	mg/片
缬草根提取物	50.00	300.00
善捷	32.67	196.02
微晶纤维素(90µm)	16.33	97.98
硬脂酸镁	1.00	6.00
片重合计	100.00	600.00

表 2: 薄膜包衣工艺参数

包衣系统	蓝色纽特斐
固含量(% w/w)	25
包衣锅转速(rpm)	13
风量(CFM)	137
雾化气压(psi)	20
扇面气压(psi)	20
喷液速率(g/min)	8-10
进气温度(°C)	59-61
排气温度(°C)	37-41
产品温度(°C)	32-40

结果

利用善捷能够改善缬草根提取物的粉末性能，使配方适用于直接压片(表3)。善捷做为填充剂制备的配方易于压片，能够制备出具有良好物理属性的完美片剂。未包衣和包衣的缬草根提取物片剂的性质如表4所示。成功应用薄膜包衣后的片剂光滑且有光泽(图1)。由于缺乏分析方法，因此未对片剂在溶出时的缬草根含量进行评估，仅对崩解时间进行测试。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中的规定(表4)。

表 3: 粉末性能概要

性能	缬草根提取物	配方共混物
堆密度(g/mL)	0.49	0.53
可压性指数(%)	33.80	21.51
粒度 d(0,5)(µm)	47.69	79.40
整体流动性	极差	易流动

表 4: 缬草根提取物速释片的性能

性能	未包衣片剂	包衣片剂
重量(mg)	604.31 ± 4.33	627.30 ± 5.60
厚度(mm)	7.80 ± 0.01	7.76 ± 0.02
硬度(kP)	14.21 ± 0.74	18.60 ± 1.30
脆碎度(%)	0.0 ± 0.0	0.0 ± 0.0
崩解时间(min)	18.53 ± 1.93	18.68 ± 1.08

图 1: 薄膜包衣的缬草根提取物片剂



结论

在缬草根提取物片剂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。使用善捷可开发出的稳健的片芯，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。

善捷克服流动性差和可压性差等配方挑战

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. Bent, S., Padula, A., Moore, D., Patterson, M., Mehlning, W. 2006. Valerian for sleep: a systematic review and meta-analysis. Am J Med. 119 (12) , pg. 1005-1012
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_valerian_CHN