

# 基于PVA的不含二氧化钛的薄膜包衣系统的评估： 提高遮盖度和颜色均匀性

Authors - Sydney Badger, Devang Patel, David Ferrizzi, and Ali Rajabi-Siahboomi  
Colorcon, Inc. Harleysville, PA 19438, USA

AAPS  
海报重印 2024

## 简介

薄膜包衣材料具有遮盖性、帮助配色以及保护活性成分免受光诱导降解的功能。二氧化钛(TiO<sub>2</sub>)作为食品色素时被归类为 E171, 是制药和营养保健应用首选增白剂和遮光剂。自 2022 年欧洲暂停使用 TiO<sub>2</sub> 作为食品添加剂以来, 企业迫切需要开发出与 TiO<sub>2</sub> 功能相同或相似的替代材料。然而, 相比于基于 HPMC 的包衣系统, 市场上大多数不含 TiO<sub>2</sub>(TF)的 PVA 包衣系统的遮盖性和颜色均匀性明显降低。因此, 市场上大多数具有良好遮盖度的 TF 系统都是基于 HPMC 的包衣系统。本项研究旨在评估一种具有高遮盖度的不含 TiO<sub>2</sub> 的 PVA 新型全配方包衣系统—欧巴代® TF(Opadry® TF), 遮盖度和颜色均匀性均有所改善。

## 目的

- 旨在评估基于PVA的不含TiO<sub>2</sub>的新型薄膜包衣系统的遮盖度和颜色均匀性
- 旨在证明优化后的高遮盖度薄膜包衣系统欧巴代TF与未优化的不含TiO<sub>2</sub>的PVA包衣系统相比效果更好

## 方法

### 遮盖度测试:

本项研究中, 将黑色薄膜包衣涂敷于 350mg 空白片芯(15%固含量, 3%增重), 然后将这些黑色片剂用来进行如下白色薄膜包衣系统的遮盖度测试:

1. 欧巴代®II(Opadry® II), 含二氧化钛的 PVA 配方
2. 欧巴代 TF, 用碳酸钙替代所有二氧化钛的 PVA 配方(未优化)
3. 欧巴代 TF, 不含二氧化钛的高遮盖性 PVA 薄膜包衣系统(经优化)

使用 O'Hara Technologies (Labcoat II)公司的 15"全孔侧通风包衣锅, 将每种配方在 20%固含量下表层包衣到 3kg 黑色底层包衣的片芯上。分别在理论增重 3%、4%和 5%下取样。利用 Datacolor 分光光度计测量表层包衣的黑色片剂, 并记录 L 值(n=10)。L 值表示样品的亮度, 从 0 到 100, 数值越高代表越白, 因此薄膜包衣越不透明。采用表 1 所示的相同参数对所有三种配方进行包衣。

### 颜色均匀性测试:

本项研究中, 用 FD&C 蓝#2 铝色淀(蓝#2)测试所有三种配方系统。使用 O'Hara Technologies (Labcoat II)公司的 24"全孔侧通风包衣锅, 将每种配方在 20%固含量下包衣到 17kg 的 500mg 对乙酰氨基酚囊型片上。分别在理论增重 3%、4%和 5%下取样。利用 Datacolor 分光光度计测量每颗囊型片(n=20)的 $\Delta E(DE)$ 值, 并与参考标准(5%WG 平均值)进行比较。DE 值大于 2.5 表明颜色不均匀, 且视觉上可明显观察出来。

使用表 1 所示的相同参数对所有三种配方进行包衣。

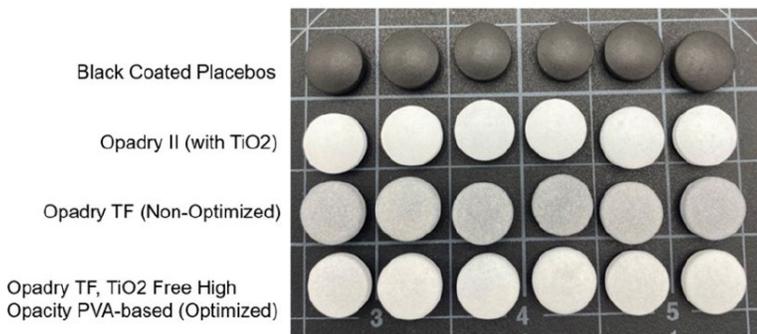
表 1: 三种配方的包衣参数

Parameter	Opacity Testing	Color Uniformity Testing
Batch Size (g)	3000	17000
Spray Rate (g/min)	18-20	60
Dispersion solids (%w/w)	20	20
Bed Temperature (°C)	45	45
Inlet Air Temperature (°C)	60	62
Air Flow (cfm/m <sup>3</sup> /hr)	165	265
Number of Spray Guns	1	2
Pan Speed (rpm)	18	14
Atomization Air (psi)	20	30
Pattern Air (psi)	20	30

## 结果

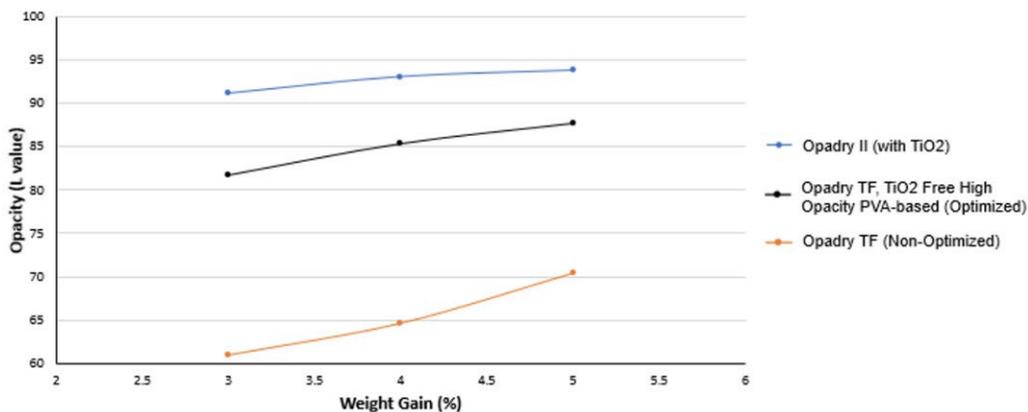
遮盖度测试:

图 1. 在黑色包衣片上 4%增重的片剂



- 优化后的欧巴代TF 和含有 TiO<sub>2</sub> 的欧巴代 II 呈白色，表明这两种系统都具有足够的遮盖度来掩盖黑色底层包衣的颜色
- 优化后的 欧巴代TF 配方比欧巴代 II 略暗。
- 未优化的欧巴代TF 系统明显呈深灰色，说明遮盖性较差

图 2. 不同增重下的 L 值



- 相比于未优化的欧巴代 TF，含 TiO<sub>2</sub>的欧巴代 II 具有更好的遮盖性。
- 优化后的欧巴代 TF， 的遮盖性更接近含 TiO<sub>2</sub>的欧巴代 II。
- 相比于未优化的欧巴代 TF，优化后的欧巴代 TF 明显具有更好的遮盖度。
- 这些结果与图 1 所示的视觉观察结果相匹配。

#### 颜色均匀性测试:

图 3. 增重 4%的对乙酰氨基酚囊型片



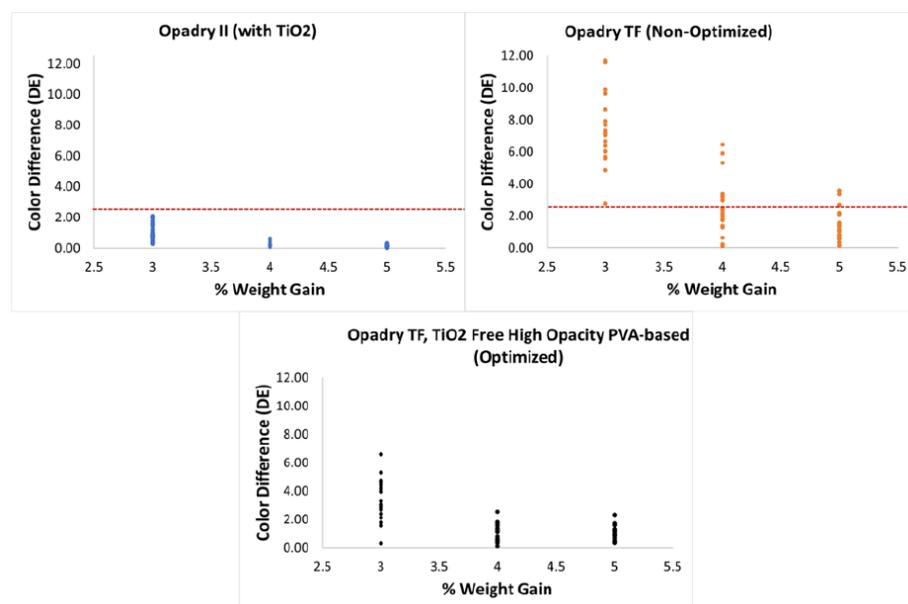
Opadry II (with TiO<sub>2</sub>)

Opadry TF (Non-Optimized)

Opadry TF, TiO<sub>2</sub> Free High Opacity PVA-based (Optimized)

- 含有 TiO<sub>2</sub>的欧巴代 II 外观呈淡蓝色
- 未优化的欧巴代 TF 外观呈鲜蓝色。
- 优化后的欧巴代 TF 比未优化的欧巴代 TF 蓝色更浅一点，颜色匹配上更接近于欧巴代 II。
- 含 TiO<sub>2</sub>的欧巴代 II 和优化后的欧巴代 TF 具有良好的颜色均匀性。
- 未优化的欧巴代 TF 则颜色均匀性较差。

图 4. 不同增重下对乙酰氨基酚囊型片的 DE 值



- 含TiO<sub>2</sub>的欧巴代II具有最好的颜色均匀性，在3% WG下达到可接受的限度(DE<2.5)，组内差异很小。
- 未优化的欧巴代TF需要超过5%WG才能达到足够的颜色均匀性，并且样品内部差异很大。

- 相比于未优化的欧巴代TF，优化后的欧巴代TF具有良好的颜色均匀性，在4% WG下达到可接受的限度，并且在所有增重下差异明显降低。

## 结论

- 优化后的不含二氧化钛、高遮盖度 PVA 新型包衣系统——欧巴代 TF，在 4% WG 下具有良好的遮盖度和颜色均匀性。相比于使用碳酸钙代替 TiO<sub>2</sub> 的其他 PVA 的 TF 系统，进步明显。
- 本配方专为满足客户需求而设计，关于 TiO<sub>2</sub> 在医药品中的应用，为欧洲任何可能发生的法规变化做好准备。

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](http://www.colorcon.com.cn) · [marketing\\_cn@colorcon.com](mailto:marketing_cn@colorcon.com)

卡乐康是一家全球公司分布在北美、欧洲、中东、非洲、拉丁美洲、印度和中国。  
[www.colorcon.com](http://www.colorcon.com)



© BPSI Holdings LLC, 2024.

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

AAPS\_2024\_Badger\_Opadry TF\_CHN