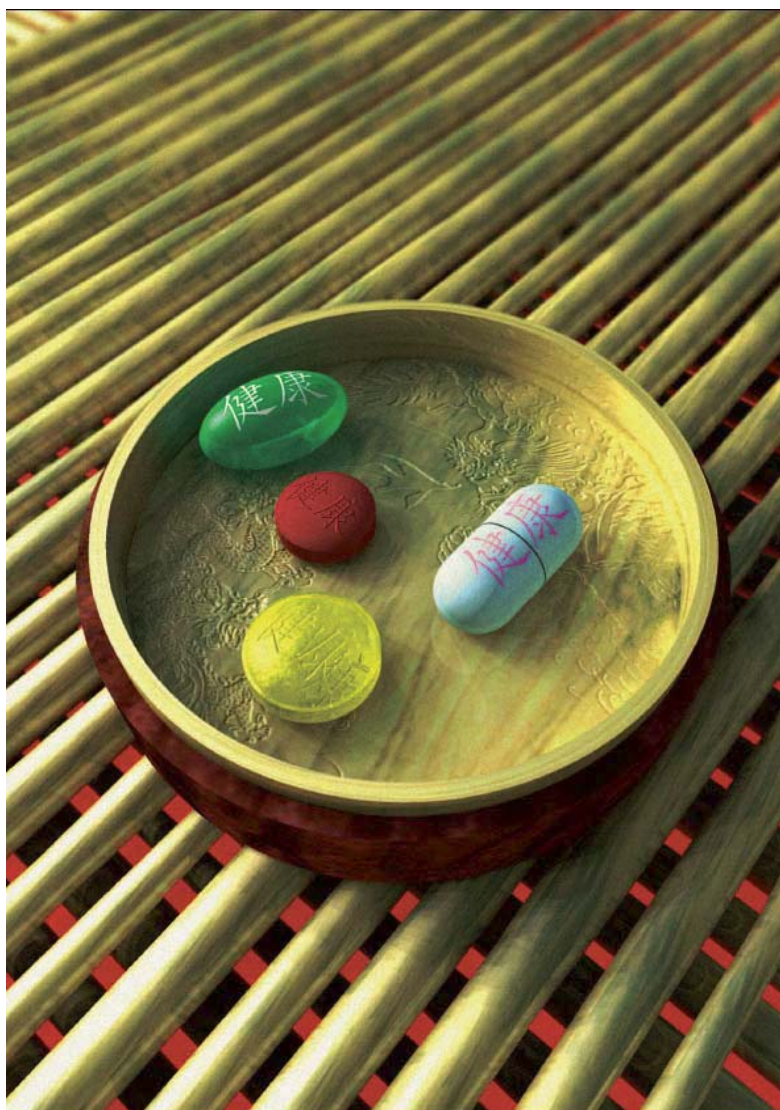


## 复方传统中药制剂：中西方文化的融合

当消费者越来越多的转向天然补品来抵抗衰老，解决营养不良或仅仅使处理忙乱生活的感觉更好些时，生产和销售天然草本健康品已成为一项全球快速增长的贸易。全世界的营养产业在2003年增长了8.4%达到了1820亿美元的销售额，补品销售额增加到5.9%，为总额增长额“贡献”了600亿美元。根据《美国营养学报(NBJ)》的调查，最大的市场为美国(200亿美元)，其次为欧洲(150亿美元)和日本(100亿美元)。<sup>1</sup>传统中药在药典更新发展过程中扮演着越来越重要的角色。然而，为了吸引现代西方消费者，古代东方医药必须与先进的配方技术相结合。本文叙述了制备的包衣片如何使中草药更可口。



天然成分如人参、荷叶和藤茶的提取物在中国已被成功应用了数千年，用于缓解常见的牙疼、咽喉痛乃至失眠和阑尾炎等等的病痛。中药结合针灸、按摩一起可从整体治疗机体，这被称为“传统中医学”。中医利

用花、种子、果实、叶子、树皮和根来配药；草药具有药性、药味、归经（对特定组织具有选择性的治疗效果）及功效等特性。

由于天然补品由天然成分组成，所以认为用它们来治疗常见病痛对机体相对较为温和，可能产生的副作用较少。许多中药制品被制售成明胶胶囊的形式；但是，这种剂型对消费者的吸引力较小且价格更昂贵，产效低。尽管这些药物的生产商继续采用胶囊的形式，但是许多中药中的营养成分难于压制或有不良气味和味道，理想的处理方法应该是掩味。

本文介绍了卡尔康在协助胶囊中药厂家评估它们的片心配方及制备薄膜衣片方面的经验，这种片剂可减少消费者的服药抵抗情绪、易识别同时更易吞咽。本文引用的案例包括1) 改善一种中草药复方片剂（用于减肥）的崩解时限；2) 优化用于治疗咽喉痛草药(藤茶)锭剂的硬度/口感/味道配方。

### 案例 #1：改善中草药复方片剂的配方

在中药片剂开发过程中，崩解时间与片剂硬度往往相矛盾，当处方中应用特殊赋形剂空间较小时，这种对处方的挑战变得更加复杂。

一般用于减肥的中药制品常常以中草药混合物装入胶囊的形式上市，但生产厂家更想做成薄膜衣片消费者更易接受。配方中包含22.5%喷雾干燥

提取物和67.5%生药粉，赋形剂仅占10%。厂家原始配方片子崩解时间长，硬度较差，选择多功能赋形剂善达™(Starch 1500®)作为赋形剂来改善崩解时间和硬度，使用快速湿法混合制粒工艺。产品配方如表I所示。

表I 减肥产品配方

成分	百分比(w/w)
活性成分混合物	90.00
美国人参提取物	
人参提取物	
荷叶提取物	
白术粉末	
大黄生粉	
善达	7.00
硬脂酸镁	0.50
蔗糖(15%水溶液作为粘合剂)	2.5
总计	100.00

将活性成份混合物和善达放置于制粒容器中，以500转/分转速混合3分钟。加入用去离子水配制的20%蔗糖粘合剂溶液，将转速提高到800转/分，剪切速度设定为1500转/分，制粒时间为2分钟。

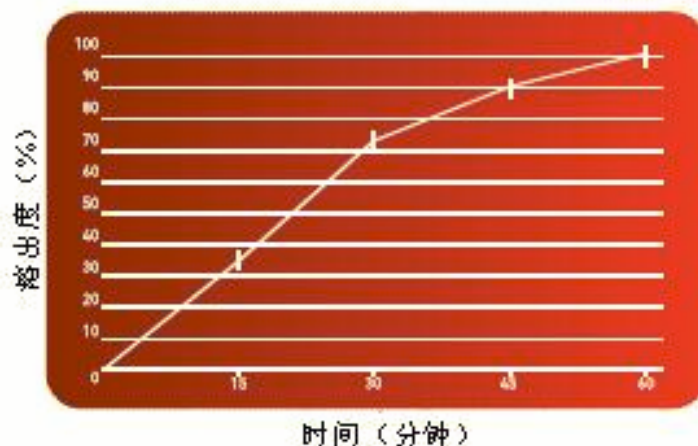
颗粒在烘箱中干燥至含水量为4%，干燥后的颗粒用16目筛整粒，加入硬脂酸镁混合后，使用Rimek Mini Press-II压片机，10mm浅凹冲，15kN的压片力压制片子，然后用Opadry II进行薄膜包衣。

使用较少量的善达改善了片芯的崩解特性和硬度(如表II)，能耐受薄膜包衣过程，最终生产出更美观的剂型。图1显示了薄膜衣片的溶出曲线。

表II 减肥中药片特性

特性	改良配方	初始配方
片重	280mg	280mg
直径	10.0mm	9.0mm
厚度	3.9mm	4.9mm
硬度	65N	130N
脆碎度	0.13%	0.25%
崩解时间	14分钟	25分钟

图1 减肥中药溶出度曲线



### 案例 #2: 改善治疗咽喉痛的中药锭剂

本研究的厂商客户所面临的挑战是通过直接压片法压制可压性差的草药来制备治疗咽喉痛的中药锭剂。除了片心硬度外，锭剂还需要有良好的口味及舒适的口感；在这种情况下，期望有奶油般滑的质地。味道和可口度对于患者依从性至关重要；有苦味的药物常常导致消费者服药主动性变差。利用薄膜包衣技术，可增加甜味、香味或掩盖不良味道且不影响崩解和溶出曲线，可改善消费者的依从性和接受度，同时可防潮，改善外观。配方中加入善达因其具有润滑性可增强直接压片所需要流动和粘合性能。

由14%喷雾干燥藤茶粉末提取物组成的中药产品，由于其遇水就会变得非常粘而不能采用湿法制粒工艺。为了避免该过程，使用直接压片工艺压制配方(表III)。

表III 藤茶提取物配方组成

成分	百分比(w/w)
藤茶提取物	14.00
麦芽糖糊精	50.00
善达	20.00
乳糖	14.00
阿斯巴甜	0.50
微粉硅胶	0.50
硬脂酸镁	0.50
柠檬香精	0.50
总计	100.00

直接压片工艺过程是将药粉和善达在混合器中混合约5分钟，加入麦芽糖糊精和乳糖后再混合5分钟，然后加入阿斯巴甜、微粉硅胶、硬脂酸镁和柠檬香精继续混合5分钟。使用Rimek Mini Press-II压片机，采用11mm浅凹冲，以15千牛的压片力压片，最后选用欧巴代® (Opadry® II, )进行包衣，欧巴代 II是由聚合物和多糖组成的干粉水性薄膜包衣系统。

压制的片子有极低的脆碎度(易碎性)，这是锭剂的一个重要特性(表IV)，薄膜包衣使药片表面平滑、高光亮、外观均匀并能防潮。光泽度通常与光滑度相关联，所以片剂显然更易吞咽。麦芽糖糊精与善达配合使用，可使含量保持均一并使消费者有舒适的口感。

表IV 锭剂药片特性

休止角(粉末混合物)	36.2°
流动时间(粉末混合物)	18.2秒
片重	500mg
直径	11.0mm
厚度	5.1mm
硬度	70N
出片力	112.5N
脆碎度	0.1%
崩解时间	15分钟

## 结论

如前所述，中药营养补充剂制成薄膜衣片的最主要的优点包括掩盖不良口味和气味，减少咽喉刺激性，通过产品更好的辨别、更佳的产品外观和接受性来提高其安全性以及降低生产成本。通过技术协助，厂商能够评估他们的核心营养药物，并通过开发可快速、方便、廉价的制成薄膜衣片的新配方、有效的使用“传统科学”与快速增长的营养补充剂市场接轨来改进他们的核心营养药物。

## 参考文献：

1. "Global Nutrition Industry IX, No. 10-11," Nutrition Business Journal (October/November 2004).

### 提供配方帮助

卡乐康作为一家研制、生产及提供制药剂专用化学品、赋形剂和高级包衣系统的全球性公司，已经为许多研制固体口服剂型配方的公司提供了帮助。在中国上海直至全球类似的从事中药的研究服务中心，卡乐康已经协助制造商来评估它们的初始核心配方，改良配方及研制新配方，可以制成薄膜衣片降低消费者的不顺应性且更加易于识别。卡乐康为可以使用哪些赋形剂，各种有效成分如何影响片剂配方的结果如脆碎度、崩解时间、硬度、防潮性和可压性等方面提供建议。由于生产药片比胶囊更便宜，包衣片与胶囊相比常更有利；与胶囊相比，药片被认为更可口、更容易吞咽。薄膜包衣被证明是改善药片快速而经济的一种方法，能提供以下优点：

- 掩盖气味/味道
- 剂型更易吞咽
- 更易识别产品，从而提高了安全性
- 改善产品外观
- 减少咽喉刺激
- 降低生产成本

更多信息请与卡乐康中国联系，电话:8009881798+86-21-54422222·传真:+86-21-54422229

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

北美  
+1-215-699-7733

欧洲/中东/非洲  
+44-(0)-1322-293000

亚太区  
+65-6438-0318

拉丁美洲  
+54-11-4552-1565



© BPSI, 2010. 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 实公司所有

[www.colorcon.com](http://www.colorcon.com)

TCM2\_labela\_CHN\_02\_2010