

利用高功能清洁标签辅料简化膳食补充剂配方

Sarah S. Aboelela, Ankit Soni*, Robert Theisen, Amelia Thomas, Rafael Gonzalez, Manish Ghimire, David Ferrizzi
Colorcon, Inc. Harleysville, PA 19438, USA

AAPS
海报重印 2023

简介

将膳食补充剂(DS)的配方开发成稳健的固体制剂可能是复杂且费时费力的。在营养保健品领域，消费者渴望清洁标签的产品包含天然(所有以植物为基础的成分)，易于识别的成分¹。有鉴于此，很有必要开发出能够减少 DS 产品开发时间和精力的营养保健品辅料。

本项研究旨在开发用于生产合格的膳食补充剂片剂的高功能清洁标签辅料。

- 新型营养保健品辅料包括纽特芯™(Nutracore™)填充剂辅料混合物和纽特芯润滑剂混合物(兼具润滑剂和助流剂特性)。
- 片剂配方中使用三种模型膳食补充剂成分：南非醉茄粉末、南非醉茄颗粒和大蒜粉。

目标：

- 评估含一系列 DS 共混物中清洁标签纽特芯对粉末特性及其片剂性能的适用性。
- 对所制备出的片剂与含有合成药用辅料或清洁标签辅料的两种市售 DS 片剂进行竞争性评估。

方法

粉末测试：根据外观、堆密度和粒度分布(PSD)评估共混物的性能。利用 Malvern Mastersizer Scirocco 2000 和 Flodex™评估 PSD 和流动性。通过纽特芯填充剂和润滑剂混合物对这三种模型 DS 粉末的粉末性能和可压性进行表征。

粉末混合物配制如表 1 所示，采用两步混合配制，其中 DS 和纽特芯填充剂混合物在 V 型搅拌机中混合 3 分钟，然后加入润滑剂混合物，再混合 2 分钟。使用 Piccola 压片机以 50rpm 的转速和 25kN 的压力将片剂直接压成 450mg、10mm 的圆弧双凸片剂。

表 1：清洁标签片剂配方的配方组成

辅料	%w/w 配方所含比例		
南非醉茄粉末	52.0	-	-
南非醉茄颗粒	-	52.0	-
大蒜粉	-	-	52.0
纽特芯填充剂混合物	45.5	45.5	45.5
纽特芯润滑剂混合物	2.5	2.5	2.5
共计	100	100	100

片剂评估:

评估所制备的片剂的外观、抗张强度(USP <1217 >)以及崩解时间(DT) (USP <701 >)。

评估 vs. 市售产品:

将纽特芯片剂特性(抗张强度和崩解时间)与两种市售膳食补充剂(DS)产品进行比较。含大蒜粉的产品是一个肠溶包衣片。为了更好地比较崩解时间,利用纽特丽®(Nutrateric®),在 3%增重(WG)下,对通过纽特芯混合物制备的大蒜片进行肠溶包衣。

结果

外观:

- 纽特芯润滑剂混合物具有浅棕色外观以及自由流动的粉末形式。
- 填充剂混合物为灰白色、自由流动的粉末,其 Flodex 值为 7-9mm,可压性指数为 24.6%。
- 纯清洁标签混合物和三种 DS 的粉末性能如表 2 所示。

表 2: 纽特芯辅料混合物和 DS 的粉末性能

材料	堆积密度 (g/mL)	粒度 (µm)		
		Dv10	Dv50	Dv90
纽特芯填充剂	0.50	31.5	97.5	202.7
纽特芯润滑剂	0.26	2.3	14.9	48.2
大蒜粉	0.52	7.4	35.7	123.6
南非醉茄粉末	0.53	7.5	26.1	62.0
南非醉茄颗粒	0.37	105.8	246.0	498.3

图 1: 清洁标签片剂 vs. 市售产品的外观



- a) 南非醉茄粉末片; a) 南非醉茄颗粒片; c) 市售南非醉茄片;
d) 大蒜片; e) 市售大蒜片

市售产品评估:

南非醉茄膳食补充剂案例研究

- 纽特芯片剂和南非醉茄市售产品的组分和片剂性能如表 3 所示。
- 用极少成分制备的纽特芯配方与市售片剂进行比较。所制备出的纽特芯片剂表面光亮、颜色均匀，无瑕疵(图 1)。
- 相比于市售产品，使用作为膳食补充剂的粉末或颗粒状的南非醉茄制备出的纽特芯片剂(未包衣)在抗张强度和崩解时间方面均优势明显，如表 3 所示。
- 使用纽特芯辅料和粉末状南非醉茄制备出的片剂的抗张强度 $>1.6\text{MPa}$ ，DT <25 分钟，比使用颗粒状南非醉茄制备出的片剂略高。

表 3: 南非醉茄片剂的组分和性能: 评估 vs.市售产品

参数	清洁标签 南非醉茄粉末片剂	清洁标签 南非醉茄颗粒片剂	市售南非醉茄片剂
组分	南非醉茄粉末, 纽特芯填充剂和润滑剂	南非醉茄颗粒, 纽特芯填充剂和润滑剂	KSM-66 南非醉茄®有机提取物, 有机葡萄糖、有机瓜尔豆胶、有机大米提取物、有机稻壳、有机阿拉伯树胶、有机葵花油、有机透明包衣
片剂性能	450mg, 圆弧形双凸未包衣片剂	450mg, 圆弧形双凸未包衣片剂	850mg, 圆弧形双凸包衣片剂
性能			
抗张强度(MPa)	2.62 ± 0.18	1.94 ± 0.15	0.65 ± 0.09
崩解时间(分钟)	23.7	16.1	58.1

大蒜膳食补充剂案例研究

- 纽特芯片剂和市售大蒜产品的组分和片剂性能，如表 4 所示。
- 尽管含有纽特芯成分的大蒜片未包衣，但相比于含有合成辅料的市售片剂，抗张强度更高，如表 4 所示。
- 市售片剂和用纽特芯辅料制备出的片剂(营养肠溶包衣纽特丽进行的包衣)的崩解时间基本相同。

表 4: 大蒜片剂的组分和性能: 评估 vs. 市售产品

参数	清洁标签大蒜片	市售大蒜片
组分	大蒜粉, 纽特芯填充剂, 纽特芯润滑剂	大蒜, 磷酸二钙, 植物纤维素, 碳酸钙, 乙基纤维素, 硅酸钙, 植物硬脂酸镁, 二氧化钛(彩色), 天然棕榈叶釉, 肠溶包衣(海藻酸钠和硬脂酸)
片剂性能	450mg, 圆弧双凸	~740mg, 肠溶包衣, 圆弧双凸
性能		
抗张强度(MPa)	2.61 ± 0.10 (未包衣)	1.75 ± 0.12
崩解时间(分钟)	46.4 3%WG, 纽特丽包衣	52

结论

纽特芯填充剂和润滑剂混合物提供更简单的清洁标签配方, 能够为南非醉茄和大蒜膳食补充剂制备出稳健的片剂。

相比于现有的市售产品, 含有标签友好型辅料的片剂配方在机械强度和崩解时间方面表现更胜一筹。

纽特芯填充剂和润滑剂混合物能够减少开发时间和成本, 有利于营养保健品的开发。

参考文献

1. Sarah S. Aboelela, Robert Theisen, Manish Ghimire, Ali Rajabi-Siahboomi. The Effect of a Clean-label, Plant-based Natural Glidant on the Flow Properties of Multiple Model Powders compared to a Synthetic Glidant, AAPS 2022.

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。即不承担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。

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。

更多信息请浏览网站: www.colorcon.com.cn



© BPSI Holdings LLC, 2023.
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_2023_Aboelela_Nutracore_CHN