

植物源性胶囊：胶囊制剂的新选择



在固体口服制剂中，硬胶囊剂是一种常见的、非常受欢迎的剂型。对于生产厂家而言，硬胶囊剂采用的辅料一般较片剂少，从处方到生产工艺都更为简单，既能降低成本，又能减少质量管理风险。据专家统计，同样成分的产品，胶囊剂的生产成本能比片剂低 30%。对消费者而言，硬胶囊剂便于吞服；其丰富的色彩、个性化的印字方案也使产品更易于辨识，不容易引起误服。据 *Nutrition Business Journal* 统计，美国的膳食补充剂中，硬胶囊剂是最常见的剂型，所占比例超过 20%。中国获得国家食品药品监督管理局（SFDA）批准的保健食品中，硬胶囊剂所占的比例超过 30%，远远领先其他剂型。

硬胶囊剂离不开空心胶囊。空心胶囊按材质可分为动物源性和植物源性两大类。动物源性的即为明胶空心胶囊。植物源性的主要是羟丙甲基纤维素（HPMC）空心胶囊。

明胶空心胶囊的主要成分是明胶和水。明胶一般来源于牛骨、牛皮和猪皮。骨和皮的主要成分胶原质经酸或碱的水解后，形成的能溶于水的小分子蛋白质，即为明胶。在欧盟，明胶被当做食品原料对待。在中国，明胶被列为食品添加剂，并未限定明胶的使用量。

在空心胶囊现代化生产的百年历史中，明胶以其广泛的来源，稳定的理化性质以及优秀的加工性能，始终保持着主流囊材的地位。上世纪 80 年代，世界著名的空心胶囊研发和生产商 CAPSUGEL 进入中国，投资建立了苏州胶囊有限公司，翻开了中国空心胶囊全自动生产的新篇章。2000 年，空心胶囊标准首次载入中国药典。针对明胶和空心胶囊行业存在的问题，2010 版中国药典大幅提高了明胶空心胶囊的标准，收紧重金属含量的标准，并增加了对铬、对羟基苯酸酯类和环氧乙烷的检测。

长期以来，国内外市场上的绝大多数胶囊剂产品采用的都是明胶胶囊。

疯牛病及口蹄疫的发生和传播使得人们开始对动物源性的产品产生担忧。业内专家不断研究和开发合适的植物源性囊材。1997 年，CAPSUGEL 率先在美国上市羟丙甲基纤维素（HPMC）空心胶囊 Vcaps®，植物源性胶囊自此形成规模化生产。2004 年，苏州胶囊有限公司引进 CAPSUGEL 拥有专利的植物胶囊 Vcaps®，并首家获得 SFDA 的羟丙甲基纤维素空心胶囊注册证。

HPMC 广泛地应用于食品药品领域，是一种常用的药用辅料，美国公认安全目录 GRAS

和各国药典都有收载。FDA 及欧盟批准 HPMC 为一种直接或间接的食品添加剂。1997 年中国卫生部批准其为食品添加剂-增稠剂(编号 20), 适用于各类食品, 按生产需要量添加[2-9]。

HPMC 空心胶囊是一种具备绿色概念的产品, 其材质及生产工艺为犹太教、伊斯兰教和素食协会所认可, 能够满足宗教及特别饮食习惯人群的需求。除此之外, HPMC 空心胶囊还具有一些独特的性质。

HPMC 空心胶囊囊壳的含水量低。明胶空心胶囊的含水量一般为 12.5%-17.5%。HPMC 空心胶囊的含水量一般为 5-8%。较低的囊壳含水量, 可以减少充填在胶囊里的成分吸收囊壳中的水分而发生变化的风险, 尤其适合于吸湿性或水分敏感性内容物, 如益生菌和某些中药, 延长产品的保质期。

HPMC 空心胶囊韧性高, 无脆碎。明胶空心胶囊有规定的水分含量, 低于这一限度就会发生明显的脆碎。明胶空心胶囊在水分含量为 10%时, 即有 10%以上的脆碎风险; 当水分持续降低至 5%时, 则会出现 100%的脆碎。相比而言, HPMC 空心胶囊的韧性要好得多, 即使环境湿度低, 也保持良好的性能。当然, 不同处方的 HPMC 空心胶囊在低湿度下的脆碎发生率会呈现较大差异。

明胶空心胶囊放置在高湿度的环境下, 囊壳吸水后会变软, 变形, 甚至塌陷。在明胶空心胶囊生产、运输、使用以及保存的过程中, 需要把环境的温度控制在 15-25℃, 相对湿度控制在 35%-65%, 方可长期保持产品的性能。HPMC 空心胶囊即使在高湿度的条件下也可保持较好的形态和性能。因此, HPMC 空心胶囊对环境的适应性很强, 当产品的销售区域覆盖多种气候带或者储存条件相对较差的时候, HPMC 空心胶囊的这一优势尤为显著。

明胶胶囊的交联反应是胶囊制剂遇到的棘手问题。由于内容物的醛基与明胶中氨基酸的氨基发生反应形成网状结构, 造成囊壳在体外溶出条件下难以溶解, 从而影响药物的释放。羟丙甲纤维素是一种纤维素衍生物, 化学惰性, 与大多数物质相容性极好, 因此 HPMC 空心胶囊没有交联反应的风险, 化学稳定性较高。

HPMC 胶囊的以上特性使其在保健品领域的应用不断拓宽, 在药品开发领域也逐渐成为全球顶尖研发团队的首选。目前, 全球以 HPMC 为主的植物源性空心胶囊的年销售量已超过 300 亿粒, 并且以每年 25%的速度增长。其中有 80%来自 CAPSUGEL 公司。该公司已上市的 HPMC 胶囊包括以下三种:



植物胶囊 Vcaps^R: 目前世界销量最大的植物源性胶囊。不仅满足素食主义及各种宗教文化的需求, 还能为吸湿性强的成分提供额外的保护。

植物胶囊二代 Vcaps Plus^R: 具有类似明胶胶囊的外观和溶出表现, 成为西药和要求快速溶出的保健品胶囊剂的首选。



耐酸型植物胶囊 DRcapsTM: 专为保健品市场设计, 不仅具备植物胶囊 Vcaps^R的各种优点, 更能有效保护产品的活性成分不受胃酸破坏, 减缓反胃等消化道的不适症状, 减少胃

部敏感的消费者在某些成分的刺激反映。

联系苏州胶囊，获取更多产品信息、全球应用实例和研究文献，帮助您更快更好推出新品。

苏州胶囊有限公司
中国 江苏 苏州工业园区苏虹中路369号
邮编: 215027
电话: 86-512-62585188, 88189188
传真: 86-512-62589188

