



## ВЛАГОЗАЩИТНЫЕ ПОКРЫТИЯ AQUAPOLISH® MS ДЛЯ ТАБЛЕТОК ВИТАМИНА С: СРАВНИТЕЛЬНОЕ ИССЛЕДОВАНИЕ ПОЛИМЕРНЫХ СИСТЕМ

Знаете ли вы, что каждая вторая таблетка витамина С, доставляемая потребителю, может потерять до 50% активности еще до вскрытия упаковки? Влага – невидимый враг фармацевтической индустрии, особенно для гигроскопичных активных веществ.

Проведено сравнительное исследование влагозащитных свойств пленочных покрытий на основе гипромеллозы (ГПМЦ) и поливинилового спирта (ПВС) для защиты гигроскопичных таблеток витамина С. Исследовано шесть составов AquaPolish® различной влагозащитной эффективности с содержанием диоксида титана и без него. Установлено, что модифицированная система AquaPolish® MS на основе ГПМЦ обеспечивает превосходную влагозащиту, сравнимую с ПВС-системами, при сохранении высоких механических свойств пленок.

### ВВЕДЕНИЕ

Защита гигроскопичных активных фармацевтических ингредиентов от воздействия влаги представляет одну из ключевых задач современной фармацевтической технологии. Витамин С (аскорбиновая кислота) относится к высокочувствительным к влаге соединениям, которые при воздействии влажности быстро окисляются до дегидроаскорбиновой кислоты и других продуктов деградации.

Даже при использовании защитной упаковки полностью предотвратить проникновение влаги невозможно, что делает

влагозащитное пленочное покрытие критически важным элементом стабилизации лекарственной формы. Традиционные покрытия на основе поливинилового спирта (ПВС) обеспечивают отличные барьерные свойства, однако их применение ограничено на некоторых рынках, что требует поиска альтернативных решений.

Цель исследования: изучение влагозащитных и механических свойств различных составов пленочных покрытий AquaPolish® для защиты таблеток витамина С, а также сравнительная оценка эффективности систем на основе ГПМЦ и ПВС.

### МАТЕРИАЛЫ И МЕТОДЫ

#### Состав таблеток витамина С

Таблетки изготавливали прямым прессованием на роторном лабораторном прессе RoTab T с использованием выпуклых пуансонов диаметром 10 мм. Состав таблеточного ядра представлен в таблице 1.

Таблица 1. Состав таблеток витамина С

Компонент	Содержание, %
Витамин С гранулированный	49,0
Микрокристаллическая целлюлоза	29,5
Прежелатинизированный крахмал	15,0
Кроскармеллоза натрия	2,5
Гидроксипропилцеллюлоза	2,0
Оксид железа желтый	1,0
Стеарат магния	1,0

Параметры таблетирования: давление основного прессования 400 МПа (20 кН), предварительного прессования 20 МПа (1 кН), скорость вращения 30 об/мин.

#### Составы покрытий

Исследованы шесть составов покрытий AquaPolish® различного полимерного состава и функциональности (таблица 2).

Таблица 2. Исследованные составы покрытий

Код	Продукт	Полимер	Влагозащитные свойства	TiO <sub>2</sub>
F1	AquaPolish® P white 010.107	ГПМЦ	-	+
F2	AquaPolish® P white 010.142	ГПМЦ	-	-
F3	AquaPolish® P white 019.177 MS	ГПМЦ	+	+
F4	AquaPolish® P white 019.160 MS	ГПМЦ	+	-
F5	AquaPolish® P white 610.19 PVA	ПВС + ПЭГ	+	+
F6	AquaPolish® P white 612.02 PVA	ПВС + ПЭГ	+	-

### Процесс нанесения покрытий

Нанесение покрытий проводили в барабанном коутере Glatt GC1 на навески по 750 г таблеток до достижения целевого прироста массы 3%, 5% и 7%. Концентрация суспензий составляла 15% для ГПМЦ-составов и 20% для ПВС-составов.

Параметры процесса нанесения:

- Температура таблеток: 39–41 °С (ГПМЦ), 44–46 °С (ПВС)
- Скорость подачи суспензии: 3,5–4,0 г/мин (ГПМЦ), 3,0–3,4 г/мин (ПВС)
- Атомизирующее давление: 1,0 бар
- Скорость вращения барабана: 9 об/мин

### Аналитические методы

**Поглощение воды:** Десять покрытых таблеток помещали в открытые чашки Петри и хранили при 70% относительной влажности и комнатной температуре. Прирост массы определяли гравиметрически.

**Механические свойства пленок:** Получение изолированных пленок методом отливки с последующим исследованием на анализаторе текстуры. Определяли упругое восстановление и релаксационные характеристики.

**Паропроницаемость:** Измерение пропускания водяного пара через пленочные образцы в климатической камере (40 °С, 75% ОВ) с использованием гидроксида натрия в качестве влагопоглотителя.

### РЕЗУЛЬТАТЫ И ОБСУЖДЕНИЕ

#### Внешний вид покрытых таблеток

Составы, содержащие диоксид титана, обеспечивают достаточную укрывистость при приросте массы 3%, тогда как для составов без TiO<sub>2</sub> требуется прирост массы 4-5% для достижения аналогичного маскирующего эффекта. Все исследованные покрытия формировали гладкие, однородные пленки без видимых дефектов.

#### Влагозащитные свойства

Результаты определения водопоглощения покрытых таблеток демонстрируют значительные различия между составами. Покрытия на основе ПВС показали превосходные барьерные свойства по сравнению с обычными ГПМЦ-со-



ставами. Однако модифицированные влагозащитные составы AquaPolish® MS на основе ГПМЦ (F3, F4) продемонстрировали существенно улучшенные барьерные характеристики.

### Механические свойства изолированных пленок

**Упругое восстановление:** Наивысший показатель упругости продемонстрировал состав F3 (ГПМЦ MS с TiO<sub>2</sub>) – 89,32 ± 1,94%, что указывает на оптимальную эластичность пленки. Составы на основе ПВС показали наименьшую упругость: F5 – 60,13 ± 3,02%, F6 – 70,23 ± 5,62%.

**Релаксационные свойства:** Покртия на основе ГПМЦ характеризовались высокой остаточной силой при релаксации (59,8–63,6%), что свидетельствует о преимущественно упругом характере деформации. ПВС-составы показали значительно меньшую остаточную силу (36,9–52,8%), указывая на пластический характер деформации.

### Паропроницаемость

Измерения пропускания водяного пара подтвердили превосходные барьерные свойства влагозащитных составов с диоксидом титана (F3, F5). Составы без TiO<sub>2</sub> характеризовались более высокой паропроницаемостью. В целом, ПВС-системы продемонстрировали лучшие барьерные характеристики, однако модифицированные ГПМЦ MS составы показали сопоставимые результаты.

### Практическое применение: защита таблеток витамина С

Сравнительное исследование стабильности показало критическую важность влагозащитного покрытия. Непокрытые таблетки витамина С демонстрировали типичный процесс деградации вследствие гидролиза с характерными изменениями цвета и потерей активности. Таблетки, покрытые 4% AquaPolish® MS, не показали

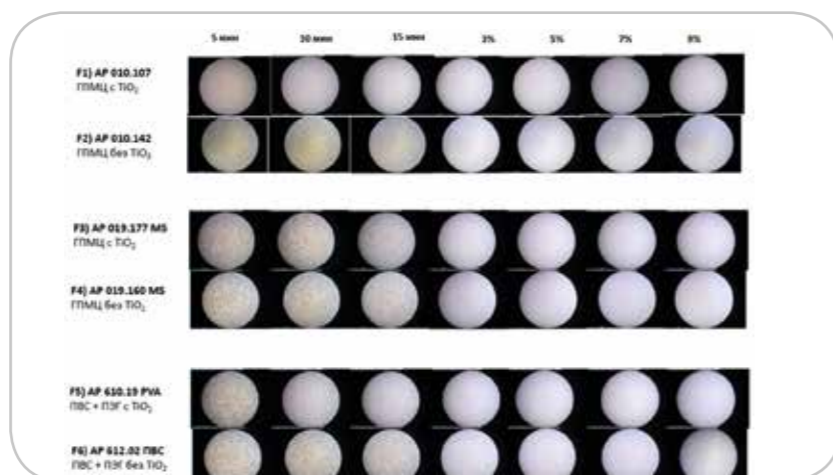


Рисунок 1. Внешний вид таблеток с различным покрытием

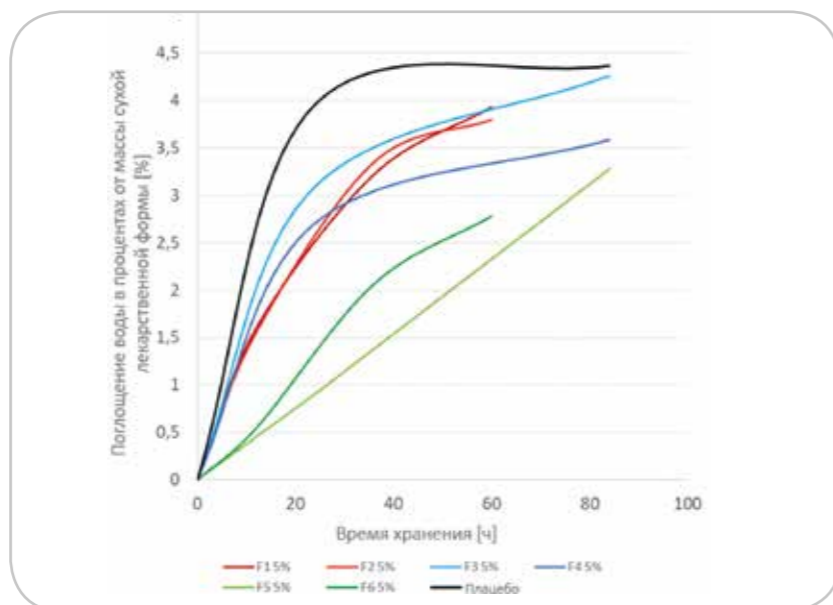


Рисунок 2. Поглощение воды таблетками с покрытием до 5% увеличения массы

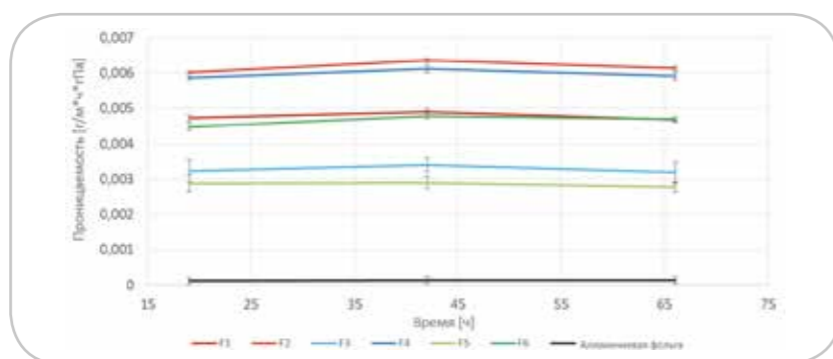


Рисунок 3. Проницаемость через пленочные оболочки в течение времени хранения

Таблица 3. Механические свойства пленочных покрытий

Состав	Упругость, %	Остаточная сила при релаксации, %
F1	84,30 ± 1,43	63,6 ± 9,4
F2	83,52 ± 7,37	59,8 ± 4,6
F3	89,32 ± 1,94	62,8 ± 5,6
F4	76,58 ± 7,81	61,4 ± 4,6
F5	60,13 ± 3,02	36,9 ± 1,9
F6	70,23 ± 5,62	52,8 ± 4,2



Рисунок 4. Сравнение внешнего вида таблеток витамина С без покрытия (слева) и таблеток витамина С, покрытых 4% (по массе) AquaPolish® MS (справа), после теста ускоренной стабильности

признаков взаимодействия с активным веществом при исследовании стабильности.

### ВЫВОДЫ

1. Влагозащитная эффективность: Модифицированные составы AquaPolish® MS обеспечивают надежную влагозащиту при приросте массы 5%, что сопоставимо с эффективностью ПВС-систем (3–5% прирост массы).

2. Механические свойства: ГПМЦ-составы, особенно F3 (AquaPolish® MS с TiO<sub>2</sub>), демонстрируют превосходную упругость (89,32%) и высокие релаксационные характеристики, обеспечивая стабильность покрытия при механических воздействиях.

3. Альтернатива ПВС: AquaPolish® MS представляет собой эффективную альтернативу ПВС-покрытиям на рынках, где применение ПВС ограничено, обеспечивая сравнимую влагозащиту при улучшенных механических свойствах.

4. Технологические преимущества: Высокое содержание твердой фазы в ГПМЦ-суспензиях (15%) обеспечивает более быстрое нанесение покрытий по сравнению с традиционными собственными рецептурами.

5. Практическое применение: AquaPolish® MS эффективно защищает гигроскопичные активные вещества, такие как витамин С, от деградации под воздействием влаги, что подтверждается результатами исследований стабильности.

Полученные результаты демонстрируют, что система AquaPolish® MS представляет собой технологически продвинутое решение для влагозащиты фармацевтических препаратов, сочетающее высокую эффективность с удобством применения и отвечающее современным требованиям регуляторных органов различных рынков.

**BIOGRUND официально получила разрешение Федерального ведомства Германии (BAFA) на поставку в Российскую Федерацию пленочных покрытий фармацевтического качества для компаний – производителей лекарственных средств. Теперь покрытия на основе гипромеллозы (ГПМЦ), поливинилового спирта (ПВС) и полиметакрилатов доступны без дополнительных согласований.**

Информация представлена исключительно в справочных целях и не является коммерческим предложением. Возможность и условия поставки определяются действующими нормативными актами Германии и Европейского союза на момент оформления заказа. ◆

**BIOGRUND**

ООО «БИОГРУНД»

Россия, 115280 Москва, улица Ленинская  
слобода, д. 19, офис R-289

+7 (495) 116-03-86

info.ru@biogrund.ru

www.biogrund.ru

