



# Liposovit-<sup>®</sup>C

## リポソビット - C

リポソーム化ビタミンC 粉末

高い安定性と生体内利用率

非アレルギー性

用途の拡大

CVDの予防

肌の健康

活力と精神的健康

運動後の再生

免疫





## Liposovit®-C とは

Liposovit®-C は、L-アスコルビン酸の需要が高まっている現状、体の多因子サポートを目的とした、微細で流動性のある**均一な粉末**の形で利用できるビタミンCです。ポーランド BART社の研究開発部門の取り組みの結果、ホスファチジルコリン（レシチン）の単二重層からなるリポソーム小胞の外部バリア、そして親水空間にL-アスコルビン酸（ビタミンC）を内包したリポソーム製剤を得ることができました（図1）。これらのリポソーム製剤は製品特性を大きく作用する独自の乾燥工程をとられております。

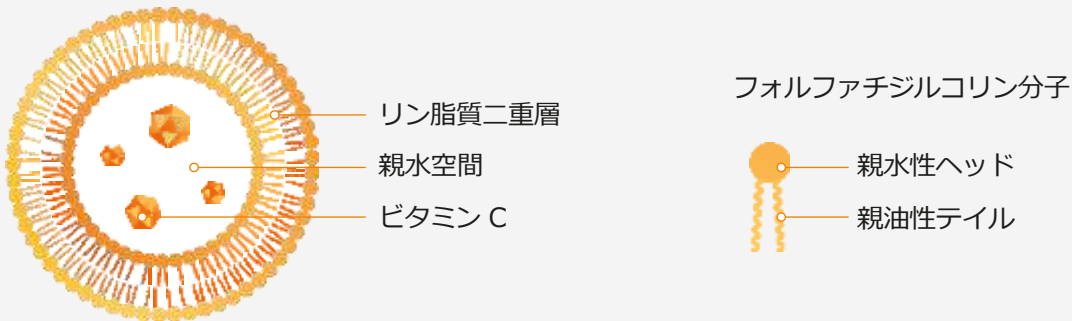


図 1. Liposovit®-C の単層ビークル模式図

## Liposovit®-C 技術の独自性

革新的な技術ソリューションを適用したリポソームの脱水粉末：

- ✓ Liposovit®-C の保存安定性が向上し、輸送中および保存中の冷却条件の必要がなくなります。
- ✓ 防腐剤を添加する必要がなく、広く知られている食物過敏症に苦しむ人々にとって安全な製品となります。
- ✓ 製造工程と最終製品でともにアルコールやその他の有機溶剤の完全除去が可能です。
- ✓ 製品のカプセル化を容易にし、粉末混合物に直接添加できます。

自社研究データでは、乾燥工程によるリポソームの品質とサイズに影響を与えません (< 300 nm)。





## Liposovit®-C の特性

当社が開発したLiposovit®-C :

- ✓ 保管中および消化管を通過中も化学的および酵素的分解からビタミンCを保護します。
- ✓ ビタミンCの摂取量を増やしても胃腸上皮を刺激から保護します。
- ✓ **臨床試験で確認**されているように、従来の形態のビタミン C と比較して、次のことが可能になります :
  - 統計的に有意な方法で補給を促進、つまり、より低用量の活性物質で同等の治療効果を達成。
  - 血流へのビタミンCの吸収が大幅に向上、これはビタミンCのより高い生体内有効率を意味します。
  - 血中ビタミンC濃度の上昇を持続させ、その結果、より長い作用を保証します。
- ✓ リポソーム小胞からビタミンCのゆっくりとした持続的徐放を可能にします。
- ✓ 十分に安全で、生分解性と生体適合性があります。

## なぜリポソーム化ビタミンC ?

元来、親水性のビタミンCは、腸上皮細胞の脂質二重層を介して体内に拡がる能力が低く<sup>(1)</sup>、その生体内利用率を制限します。アスコルビン酸は不安定で、温度、光<sup>(2,3)</sup>、pH の上昇に敏感で<sup>(2)</sup> 非常に酸化されやすいものです<sup>(2,3)</sup>。

入手可能な文献データによると、ビタミンCの安定性と生体内利用率を高める効果的な方法は、ナノカプセル化、特に脂質キャリアにおいてです。これらのキャリアは医薬品、食品、農業において最も汎用的に使用され、リポソームも含まれます<sup>(3)</sup>。

リポソームは活性物質の内包に非常に効果的で、酸素、他の食品成分<sup>(4)</sup>、不適正な pH、光、または消化酵素<sup>(6)</sup>の存在による活性物質の分解から保護し、安定させます<sup>(4,5,6)</sup>。またリポソームは活性物質が標的組織に到達する前に代謝されるのを防ぎます<sup>(5)</sup>。同時に栄養素をリポソーム小胞に内包させるカプセル化は、腸内でも上皮刺激などの副作用を最小限に抑えます<sup>(7)</sup>。リポソーム化ビタミンCを1日1~2gを超える最適な量を摂取すると、敏感な人の胃腸障害のリスクが有意に低下する可能性があります<sup>(8,9)</sup>。これは浸透性下痢も含みます<sup>(10)</sup>。

リポソーム小胞の生体膜との構造的類似性は、活性物質の腸管吸収を促進し、生体内利用率を高め、結果的に有効性を高めます。リポソーム製剤の場合、活性物質の細胞への運搬は、細胞融合または取込（エンドサイトーシス）のいずれかによって制御されています<sup>(7)</sup>。動物とヒトを含む数多くの実験的研究の結果は、リポソーム形態のビタミンCが従来の形態よりも優れていることを示しています<sup>(4,11,12)</sup>。これは **Liposovit®-C**についてBART社で実施された独自研究でも確認されており、その結果を以下に示します :





## Liposovit®-C の独自研究

Liposovit®-Cの生体内利用率の向上を確認するため、無作為化、二重盲検、クロスオーバー、単回投与の臨床試験が実施されました (n = 10<sup>1</sup>, 生命倫理委員会の承認番号: KB/121/2021)。健康な被験者は、1gのLiposovit®-C (カプセルに入った粉末) を摂取し、2週間のウォッシュアウト期間の後、1gの従来のビタミンC (カプセルに入った粉末) を摂取しました。アスコルビン酸濃度 (UPLC) は、調査対象のサプリメントの投与直前、および投与後30分、1時間、2時間、3時間、4時間、6時間、8時間、10時間、および24時間後に各被験者から採取された血液サンプルで測定されました。両方の形態のビタミンCについて得られた薬物動態プロファイルとパラメーターをそれぞれ図 2 と表 1 に示します。

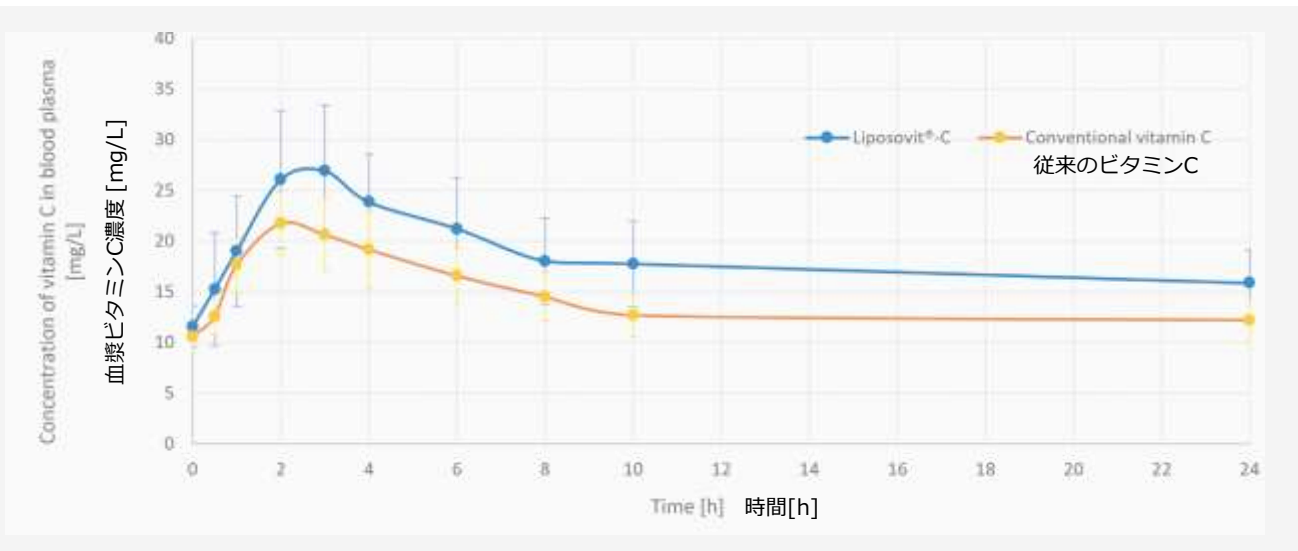


図 2. Liposovit®-C およびその非リポソーム相当物の薬物動態プロファイル

表1. 調査対象のビタミン C カプセル 1 g の用量で得られた薬物動態パラメーター

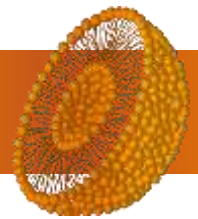
特定のパラメーターの結果は、9 人の参加者に関する研究の平均値 ± SD を表します。

	従来のビタミン C	Liposovit®-C
AUC* [mg x h/l]	342.12 ± 45.22	444.95 ± 97.24
T <sub>max</sub> [h]	2.33 ± 0.71	2.56 ± 0.53
C <sub>max</sub> [mg/l]	22.52 ± 3.39	27.95 ± 6.46
C <sub>10h</sub> ** [mg/l]	12.68 ± 2.11	17.76 ± 4.24
C <sub>24h</sub> * [mg/l]	12.18 ± 2.07	15.85 ± 3.26

\*p<0.05, \*\*p<0.01; n=9

<sup>1</sup> 食事に関するインタビューでビタミン C サプリメントの摂取が明らかになったため、1 人の被験者の結果は削除されました。





臨床試験の結果、従来の形態のビタミンCと比較して、**Liposovit®-C**により、次のことが可能になります：

- 統計的に有意な方法で補充を促進、すなわち、活性物質のより低い用量で同等の治療効果を達成
- 血流へのビタミンCの吸収がはるかに良くなり、生体内利用率が高いことを示します（AUCが30%増加、 $p < 0.05$ ）
- 血中のビタミンC濃度の上昇を長引かせ（ $C_{24h}$ が30%高い  $p < 0.05$ ）、結果として効用が長くなります。

図3は、競合製品の画像と比較した**Liposovit®-C**の顕微鏡画像です。

写真はライカ DM2500LED 光学顕微鏡で撮影したもので、倍率は10倍と50倍です。

競合製品と比較すると、**Liposovit®-C**は均一な色と分子サイズで際立っています。

さらに、競合他社品と異なり、**Liposovit®-C**には純粋なビタミンC結晶が含まれていません。

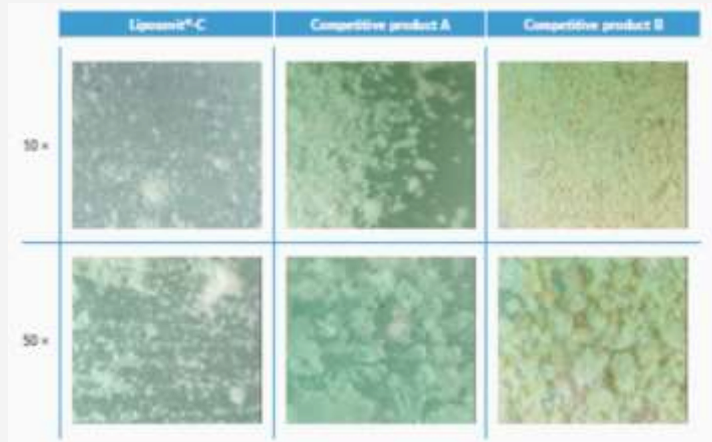


図3. Liposovit®-C と競合製品の顕微鏡写真。

リポソーム小胞を液体から粉末にする**当社の乾燥プロセス**は、形成されたキャリア粒子の**品質と粒径に悪影響を与えません**。これは、LUMiSizer® アナライザーによる分析で確認されています。

**Liposovit®-C** の製造工程中に得られる液体と最終的な粉末の両方を分析した測定結果を表 2に示します。どちらの形態でも、リポソームのサイズは 300 nmを超えておりません：

- ビタミンCの液体バリエーションは267 +/-10 nm
- 最終的な粉末バリエーション (**Liposovit®-C**) は 261 +/-10 nm。

表2. Liposovit®-C の液体および粉末形態の粒子径測定の結果

変位値	
Liposovit®-C 液体形態	Liposovit®-C 粉末形態
10% of distribution ≤ 183.3 nm	10% of distribution ≤ 196.3 nm
16% of distribution ≤ 216.8 nm	16% of distribution ≤ 209.2 nm
50% of distribution (D50) ≤ 266.9 nm	50% of distribution (D50) ≤ 260.6 nm
84% of distribution ≤ 317.9 nm	84% of distribution ≤ 324.6 nm
90% of distribution ≤ 327.5 nm	90% of distribution ≤ 345.9 nm

**Liposovit®-C**の非常に有益な特性と当社独自の技術（臨床試験で示されている従来のビタミンCと比較して増強された補給を含む）は、栄養補助食品の製造において、革新的なりポソーム技術を使用することが有意義であることが確認されており、リポソームがこのセグメントの未来を代表するものと確信しております。





## 参考文献

1. Dima C et al. Compr Rev Food Sci Food Saf. 2020;19(3):954-994. doi: 10.1111/1541-4337.12547
2. Michels AJ, Frei B. Nutrients. 2013;5(12):5161-92. doi: 10.3390/nu5125161
3. Jampilek J, Kralova K. Nanomaterials (Basel). 2020;10(11):2224. doi: 10.3390/nano10112224
4. Kirby CJ et al. Int J Food Sci Technol. 1991;26:437-449 <https://doi.org/10.1111/j.1365-2621.1991.tb01988.x>
5. Bozzuto G, Molinari A. Int J Nanomedicine. 2015;10:975-99. doi: 10.2147/IJN.S68861
6. Subramani T, Ganapathyswamy H. J Food Sci Technol. 2020;57(10):3545-3555. doi: 10.1007/s13197-020-04360-2
7. Aqil F et al. Cancer Lett. 2013;334(1):133-41. doi: 10.1016/j.canlet.2013.02.032
8. Lykkesfeldt J et al. Adv Nutr. 2014;5(1):16-18. doi: 10.3945/an.113.005157
9. EFSA Panel on Dietetic Products, Nutrition and Allergies (NDA); EFSA Journal 2010; 8(10):1815 [20 pp.]. doi:10.2903/j.efsa.2010.1815
10. Institute of Medicine (US) Panel on Dietary Antioxidants and Related Compounds. Washington (DC): National Academies Press (US);2000. doi: 10.17226/9810
11. Khalili A et al. Iran J Med Sci. 2020;45(1):41-49. doi: 10.30476/ijms.2019.45310,
12. Hickey S et al. J Nutr Environ Med 2008, 17(3):169-177, doi: 10.1080/13590840802305423.

注: この資料はビジネス用のもので業務ユーザー向けに作成されています。特に消費者とのコミュニケーションにおいて、この資料の全部または一部を許可なく使用することは禁止されています。

