

# actifs

L'Actualité des Ingrédients Fonctionnels & Santé  
News on Functional & Health Ingredients

**EVENT**

**Vitafoods**  
Clinical studies  
to support  
business  
growth



May - June \ Mai - Juin 2015 - N°46

## **ANTI-AGING**

Antioxidants 2.0  
for the skin

## **MINERALS**

Magnesium,  
the outstanding  
mineral

## **INNOVATION**

Polyphenols  
on vascular  
endothelium

## **GELATIN**

Innovation  
in formulation

## **FOOD SUPPLEMENTS RANKING IN THE WORLD**

**EHPM :**  
Establish  
a more serene  
relationship  
in Europe

**France : A market  
of €1.4 billion**

# NOVASTELL

INGRÉDIENTS ESSENTIELS

*Phospholipids  
for life*

PA

Phosphatidic acid extracted from plants

PS

Phosphatidylserine extracted from plants

PC

Phosphatidylcholine extracted from plants

Ω

Omega 3 in the form of phospholipids



077

QUALITY  
TRACEABILITY EXPERTISE

NOVASTELL

[www.novastell.com](http://www.novastell.com) / [info@novastell.com](mailto:info@novastell.com)

+33 (0) 232 55 65 40

# Actifs nutraceutiques : ne pas oublier la *Nutraceutical actives: do not forget vectorization*

Et si la vectorisation d'un actif devenait au moins aussi importante que l'actif lui-même ? On le sait : le développement d'un composé actif destiné à la nutraceutique est long, onéreux, et pas toujours couronné de succès (pressions réglementaires, etc.). Utiliser dans une formulation le meilleur des actifs, produit dans les meilleures conditions, ne sert pas à grand-chose si on ne s'assure pas qu'il est utilisé correctement par l'organisme. Optimiser l'efficacité de la délivrance est un excellent levier d'optimisation à la fois technique et économique en matière d'innovation. Explications par Marie Bellenger, en charge de la R&D chez Novastell, qui propose le concept Vectocholine.

*What if an active's vectorization became at least as important as the active itself? It is well known: the development of an active compound dedicated to nutraceutical takes time, money, and it is not always met with success (regulatory constraints etc.). Formulating with the best of actives produced under the best conditions does not help much if one does not make sure that the formulation is correctly used by the body. Improving active delivery efficiency is therefore an excellent optimization leverage which is both technical and economical as far as innovation is concerned. Explanations by Marie Bellenger, R&D Manager of Novastell, which proposes the Vectocholine concept.*

116

## Actif's Magazine :

**Pouvez-vous rappeler les techniques dont disposent les industriels pour s'assurer que leurs ingrédients soient délivrés au bon endroit ?**

*Could you please sum up the techniques industrials have at their disposal to secure the delivery of their actives to the right site?*

## Marie Bellenger :

De nombreuses techniques d'encapsulation existent. Elles regroupent des choses assez différentes. En effet, l'assimilation d'un actif passe par plusieurs étapes. Prenons l'exemple de l'absorption par voie orale « classique ».

Tout d'abord, il est nécessaire de s'assurer que l'actif parvienne jusqu'à la « porte d'entrée » de l'organisme (ce sont les entérocytes de la paroi du tube digestif) en bon état : ni oxydé, ni dégradé par le pH acide de l'estomac, par exemple. Sont utilisées des techniques d'encapsulation dans des gommages, alginates, levures, etc., qui vont jouer un premier rôle de protection physique de l'actif encapsulé

Deuxième étape : l'actif doit ensuite franchir cette porte d'entrée – autrement dit, les entérocytes de la paroi du tube digestif. C'est la capacité d'un actif à pouvoir le faire qui définit sa biodisponibilité. Pour cela, cet actif doit avoir une taille suffisamment réduite afin de pouvoir être véhiculé à travers cette barrière. Sont utilisées des techniques permettant d'augmenter la solubilité des actifs non hydrosolubles – comme par exemple des cyclodextrines, mais aussi des complexes du type liposomes/phytosomes formés à partir de phospholipides et qui vont eux-mêmes servir de véhicules en fusionnant avec la paroi des entérocytes.

Enfin, troisième et dernière étape : une fois cette porte franchie, l'actif se retrouve dans le système lymphatique – qui n'est encore bien souvent pas la destination finale. Il faut encore s'assurer que l'actif va être utilisé pour ce pour quoi on l'attendait... Une précision : une autre barrière, encore plus sélective que celle de la paroi intestinale, doit parfois être franchie. Il s'agit de la barrière hémato-encéphalique notamment, qui isole le cerveau du reste de l'organisme.

Cette barrière est, elle aussi, composée de phospholipides... La route est longue pour qu'un actif puisse être délivré au bon endroit.

*There are various encapsulation techniques. They encompass quite various aspects. Indeed, the assimilation of an active passes through several stages.*

*First of all, it is necessary to make sure that the active actually gets to the "entry gate" of the body (namely the enterocytes in the wall of the digestive tube) in good condition: neither oxidized, nor degraded by the acid pH in the stomach, for instance. Encapsulation techniques based on gums, alginates, yeasts etc. are used and they are the ones that will play the first physical protection role for the encapsulated active.*

*Second stage: the active must then pass through this entry gate – in other words, through the enterocytes in the walls of the digestive tube. It is an active's capacity to do this that defines its bioavailability. This is why an active must have a sufficiently small size that allows it to cross this barrier. Techniques that allow increasing the solubility of non-hydrosoluble actives are used, such*

# vectorisation

*as cyclodextrins, but also liposome/phyto-some complexes derived from phospholipids, which will act as vehicles themselves by merging with the wall of the enterocytes. Finally, the third and last stage: once this gate is passed through, the active arrives in the lymphatic system – which is not yet the final destination. We must make sure once again that the active will be used for its intended purpose... Please note that another barrier, possibly more selective than the intestinal wall, must sometimes be crossed. It is the blood-brain barrier, which isolates the brain from the rest of the body. This barrier is, in its turn, composed of phospholipids... Long is the road before an active is delivered to the right place.*

## Actif's Magazine :

**Vous utilisez le concept de vectorisation. Quelles en sont les grandes lignes ? Et qu'apportez-vous de nouveau ?**

*You use the concept of vectorization. What are its underlying principles? And what novel features do you propose?*

## Marie Bellenger :

Le concept de vectorisation, en tant que tel, est utilisé depuis quelques années en cosmétique et en nutrition, y compris avec des phospholipides.

Les phospholipides ont un triple intérêt en matière de vectorisation. Ils sont amphiphiles et participent naturellement à l'émulsion des molécules dans l'intestin en formant des micelles. Ils sont aussi un élément essentiel des membranes des entérocytes, et ont la capacité de fusionner avec ces membranes en important en même temps les actifs qu'ils véhiculent. Leur troisième intérêt, qui n'avait pas été exploité jusque-là, est qu'ils peuvent être, dans certains cas, eux-mêmes des actifs. Ils jouent en effet des rôles essentiels dans de nombreux processus métaboliques. Il est donc possible, en choisissant bien les types de phospholipides utilisés pour vectoriser un actif, d'avoir une action synergique de l'actif encapsulé et de son véhicule.

Je vous donne un exemple. En utilisant nos phospholipides marins pour vectoriser un actif à visée « mémoire », il est non seulement possible d'optimiser la biodisponibilité de l'actif vectorisé, bien sûr, mais aussi d'apporter en même temps, via les phospholipides utilisés, de la phosphatidylcholine impliquée dans la transmission du message nerveux, et du DHA – qui plus est sous la forme la plus efficace pour l'organisme.

Ce concept est novateur dans le sens où personne n'avait jusqu'ici pensé à utiliser et à mettre en avant cet aspect « synergique » d'un vecteur et de l'actif qu'il véhicule. Mais cela nécessite une bonne connaissance des phospholipides, dont la diversité ne s'arrête pas à la simple lécithine de soja.

*The concept of vectorization, as such, has been used for a few years in cosmetics and nutrition, including for phospholipids.*

*Phospholipids have a triple interest for vectorization. They have an amphipathic character and they are naturally involved in the emulsion of molecules in the intestine as they form micelles. They are also an essential element of the enterocyte membranes and are able to merge with these membranes while also delivering the active they carry.*

*Their third interest, that had not been previously explored, is that, in some cases, they can act as actives themselves. They actually play an essential role in a wide number of metabolic processes. It is therefore possible, if choosing well the types of phospholipids used for the active's vectorization, to exert the synergetic activity of the encapsulated active and its vehicle.*

*Here's an example. By using our marine phospholipids for the vectorization of an active targeting "memory", it is possible not only to optimize the bioavailability of the active subject to vectorization, but also to provide, via the same phospholipids, the phosphatidylcholine involved in the transmission of the nervous message, as well as DHA – which is, moreover, in its most effective form for the body.*

*This concept is a novel one inasmuch nobody had previously considered using and putting forward this "synergetic" dimension of the vector and the active it delivers. But this also implies a good knowledge of phospholipids, whose diversity does not end with soy lecithin.*

## Actif's Magazine :

**Ces systèmes de transport/vectorisation peuvent donc être considérés comme des actifs ?**

*These transportation/vectorization systems can therefore be considered actives?*

## Marie Bellenger :

A ma connaissance, il s'agit d'une voie qui n'a pas été explorée jusqu'ici. Par ailleurs, je ne connais pas de rôle « actif » pour les autres vecteurs couramment utilisés (alginate, cyclodextrine, maltodextrine, etc.).

*As far as I know, it is a pathway never explored before. In fact, I do not have any knowledge of any other vectors currently used (alginate, cyclodextrin, maltodextrin etc.) having an "active" role.*

## Actif's Magazine :

**Qu'est-ce que cela change pour l'industrie de la nutraceutique ?**

*What is the impact for the nutraceutical industry?*

## Marie Bellenger :

L'intérêt de ce concept de vectorisation réside dans la possibilité qu'il offre de donner un nouveau souffle à des actifs « vieillissants » ou peu utilisés de par leur faible biodisponibilité naturelle, en optimisant leur efficacité. Cela ouvre un vaste océan des possibles en terme d'innovation pour les producteurs d'actifs comme pour les formulateurs. Avec la possibilité en prime de surfer sur la vague de l'utilisation « durable » des ressources : un actif plus efficace peut être dosé plus finement. Il est ainsi possible de déplacer sa valeur du « quantitatif » vers le « qualitatif »...

*The interest of this concept of vectorization lies in that it offers the possibility to breathe new life into the "aging" or scarcely used actives due to their low natural bioactivity by optimizing their efficacy.*

*This opens up a wide array of possibilities in terms of innovation both for the active ingredients manufacturers and formulators. Which moreover opens the door to a "sustainable" use of resources: a more efficient active can be more finely dosed. It is thus possible to shift one's value from "quantitative" to "qualitative"... ■*