

29-0659

汎用性手法による口腔内速崩壊錠の処方設計に関する研究

○三宅 由子¹, 長谷川 正樹¹, 谷口 洋子¹, 日比野 剛¹ (¹ 三重科技工研部・医薬研セ)

【目的】口腔内速崩壊錠は現在 30 数品目が市販されているが、それらの製法は特許によりガードされている。そこで我々は、通常の賦形剤と設備を用いた口腔内速崩壊錠の処方設計について検討した。崩壊時間が 3 分以内で、なおかつ硬度が 40 N 以上の錠剤を目標とした。

【方法】賦形剤 2 種 (450 mesh 乳糖及び噴霧乾燥造粒乳糖) と崩壊剤 7 種 (primojel、PCS、L-HPC、ECG505、NS-300、Ac-Di-Sol、及び c-Povid) の組合せについて、それぞれ 7 : 3 の割合で混合し、練合法、流動層法、及び直打法により錠剤を成形した。また崩壊性促進のために、糖添加、賦形剤の微細化、崩壊剤の添加時期と至適濃度について検討した。

【結果・考察】450 mesh 乳糖と L-HPC、NS-300、及び c-Povid、噴霧乾燥造粒乳糖と primojel、L-HPC、及び NS-300 の組合せで、速やかな崩壊性と十分な硬度を備えた錠剤を得たが、NS-300 が最も効果的であった。乳糖のタイプを比較するとき、450 mesh 乳糖は錠剤硬度によらず、速やかな崩壊性を示した。一般に崩壊性がよいと言われる直打法よりも、練合法や流動層法で製した錠剤の方が崩壊が速やかであった。錠剤内への水の取込みを促進するため糖添加を試みたところ、マンニトールが有効であり、至適濃度は対乳糖比 70% であった。NS-300 の添加時期は造粒時添加が有効で、添加濃度が 30% の場合に最も崩壊性が良好であった。