

28N-am07

ラクトフェリン封入キットサン微粒子の調製と評価

○渡邊 研一¹, 大西 啓¹, 町田 良治¹ (1星薬大)

【目的】ラクトフェリン (LF) は鉄結合性糖蛋白質で抗菌作用、免疫賦活作用、抗炎症作用等を示し、様々な疾患への応用が期待されている。しかし、経口投与では LF の分解や低い吸収率により作用が減弱すると考えられる。キトサン (Ch) はキチンの脱アセチル化体で吸収促進作用があり、蛋白質の吸収改善に有効であることが報告されている。本研究では腸からの吸収促進および炎症部位への送達を目標とし、Ch をキャリアーとして LF の微粒子製剤化を試み、*in vitro* における粒子特性、放出特性について検討を行った。

【方法】LF と Ch を 1% (v/v) 酢酸水溶液に溶解後、乳化剤を 1% 含有する流動パラフィンに滴下し W/O エマルジョンを形成させた。その後、液中乾燥法により LF-Ch 微粒子を調製し、走査型電子顕微鏡 (JFC-1600LV; 日本電子株式会社) により、形状の観察、平均粒子径、粒度分布の測定を行った。さらに、LF の含有率、封入効率、放出性を検討した。

【結果】LF の配合量によらず粒子径が約 2 μm の均一な球形微粒子が調製できた。微粒子の粒度分布から LF : Ch = 3 : 5 (w/w) で最も均一な粒子径を示す微粒子が得られた。また、この条件において含有率、封入効率は高く、再現性も良好であった。LF の放出試験から第一液では 1 時間で 60-80% の LF が放出されたが第二液では LF : Ch = 1 : 5 (w/w) を除いて 48 時間後まで LF の持続的放出が観測された。

【考察】LF-Ch 微粒子の平均粒子径はいずれの処方においても約 2 μm であり、細胞膜の浸透促進やパイエル板の M 細胞による取り込みに適しているサイズであると考えられた。LF : Ch = 3 : 5 の処方は他の処方と比べて粒子の均一性が高く、また含有率および封入効率も最も高いことから、最適な処方であると考えられた。