

28N-am01

ナリンゲニン封入HPMCPナノスフェアの設計

○岸 潤一郎¹, 片桐 大介¹, 戸塚 裕一¹, 竹内 洋文¹, 岡 和生², 三島 敏² (1岐阜薬大, ²アピ)

【目的】当研究室では、薬物送達のための微粒子製剤の開発を展開している。これまでに、いくつかのモデル薬物を用いて微粒子製剤による経口吸収性向上の可能性を実証してきた。有効成分を効率よく体内に送達することは、医薬品に限らず、近年開発の盛んな健康食品においても重要である。本研究では、健康食品の一つであるプロポリス製剤設計にナノ粒子を適用することを目的として、高分子ナノスフェアへの封入の可否、動物を用いた吸収実験を行った。

【方法】プロポリスの成分の一つであるナリンゲニンモデル活性成分として選択した。ナリンゲニン封入 HPMCP ナノスフェア (HPMCP NS) の調製には、水中エマルジョン溶媒拡散法を適用した。HPMCP とナリンゲニンの溶液を、外水相中に攪拌下滴下し、ナリンゲニン封入 HPMCP NS を得た。調製したナリンゲニン封入 HPMCP NS の懸濁液と、対照としてナリンゲニン溶液を、それぞれラットに経口投与し、その血中ナリンゲニン濃度を調べ、ナリンゲニンの腸管吸収性を評価した。

【結果・考察】HPMCP 処方量を減少させるに従い粒子径は小さくなり、最適調製条件化では、粒子径約 70 nm、薬物封入率は 80 %を超える良好なナノ粒子が得られた。動物実験では、ナリンゲニンの溶液に比べ NS では、速やかな血中濃度の上昇が見られ、最高血中濃度は投与後 1 時間で溶液投与の約 3 倍に達し、有意に吸収性を改善することが出来た。HPMCP は投与後腸内 pH 下で直ちに溶解し、ナリンゲニンの吸収性が改善されたものと考えられる。