

ラクトフェリン経口投与のための微粒子製剤開発

○大西 啓<sup>1</sup>, 小山 憲一<sup>2</sup>, 町田 良治<sup>1</sup>(<sup>1</sup>星薬大,<sup>2</sup>同愛記念病院薬)

【目的】ラクトフェリン (LF) は、抗菌、抗癌および抗ウイルス作用を示し、抗炎症作用や免疫調節作用を有する鉄結合性糖蛋白質として、その機能性が注目されている。しかしながら、単純に経口投与した場合、消化管内で分解を受けやすいことや受容体近傍における滞留性や送達性が良好ではないことから、その有効性改善のための工夫が望まれている。本研究では、LF の有効利用を目的として、高分子を担体に用いることにより、LF の微粒子製剤化を試みた。

【方法】LF としてウシラクトフェリンを用い、定量化のためにフルオレセインイソチオシアネート (FITC) で標識化を行い、FITC 標識化 LF (LF-FITC) を調製した。アルギン酸ナトリウム (AL・Na) と LF-FITC を含有する水溶液を界面活性剤を含む流動パラフィン中に投入し乳化した後、10% (w/v) 塩化カルシウム水溶液を添加し、減圧下で攪拌しながら水を留去することにより、LF-FITC 含有アルギン酸カルシウム微粒子 (AL/Ca-LF-FITC) を調製した。さらに、この粒子をキトサン含有酢酸水溶液に投入することで、キトサンコーティング微粒子 (CH/AL/Ca-LF-FITC) を調製した。粒子径、粒子の物理的安定性、放出性について検討を行った。

【結果および考察】数百ナノメートルから数マイクロメートルの微粒子を得ることができた。キトサンコーティングを行った際、キトサンの濃度を上昇するほど、LF-FITC の含有率の低下が見られた。CH/AL/Ca-LF-FITC 微粒子の形状は、日局第1液、第2液中において安定に保持された。また、各液において徐放性が観測された。今回得られたキトサンコーティング微粒子は、経口投与可能な LF 徐放性微粒子製剤として利用しうることを示唆された。