

30pmL-010

CD 水溶液と SMEDDS 製剤または液晶製剤の併用によるジオスゲニン生物学的利用能および皮膚移行性の改善

○大川原 正喜¹, 藤堂 浩明¹, 橋本 フミ恵¹, 杉林 堅次¹, 徳留 嘉寛¹(¹城西大薬)

【目的】ジオスゲニンは wild yam (*Dioscorea villosa*) などに含まれるステロイドサポニンで、糖尿病や脂質異常症の改善作用が報告されている。B16 メラノーマ細胞におけるメラニン産生抑制作用や、ヒト 3 次元皮膚モデルにおける細胞増殖促進作用が報告されており、美容や健康の増進を目的とした食品の有効成分として注目されている。これまでに我々はジオスゲニン経口投与後のラットにおける生物学的利用能 (BA) は低値を示し、低い BA や皮膚移行性はシクロデキストリン (CD) 包接、自己微小乳化型薬物送達システム (SMEDDS) 製剤、液晶製剤によって改善されることを報告してきた。本研究では、CD 包接と SMEDDS 製剤または液晶製剤の併用がジオスゲニンの BA および皮膚移行性に与える影響を評価した。

【方法】SMEDDS 製剤は Capryol 90 にジオスゲニンを溶解し、Cremphor EL、Carbitol と 4:3:3 (v/v) の割合で混合することによって調製した。液晶製剤は glyceryl monooleate および phytantriol にジオスゲニンを溶解することにより調製した。製剤は粒子径測定法 (Zetasizer Nano-ZS ZEN 3600, Malvern)、溶解度測定法によって評価した。製剤または製剤と CD 水溶液を Wistar ラットに経口投与し、得られた血漿中のジオスゲニン濃度より動態パラメータを算出した。また、投与 6 時間後の皮膚を採取し、皮膚移行性を評価した。

【結果・考察】SMEDDS 製剤および液晶製剤を希釈して粒子径を測定した結果、粒子径はそれぞれ、約 50 および 100 nm であった。溶解度試験の結果より、SMEDDS 製剤および液晶製剤に CD 水溶液を添加することでジオスゲニン溶解度は改善された。また、CD と製剤の併用により非包接ジオスゲニン製剤群と比べて高い血漿中濃度および皮膚移行性を示し、CD 併用の有用性が示された。