

27J-pm02S

難水溶性薬物を含む固体脂質微粒子製剤の開発

○片山 創太¹, 池内 由里¹, 仁賀 萌奈美¹, 笹津 備尚¹, 大西 啓¹ (1星薬大)

【目的】これまでの研究で、抗酸化物質であるモリン(MO)は、糖尿病モデルマウスにおいて優れた脂質過酸化抑制作用を示すことが明らかとなった。しかしながら、MOは難水溶性薬物であり、生物学的利用能が非常に低いことが指摘されている。そこで、MOを固体脂質微粒子(SLP)に封入した製剤を開発することで、経口投与においてMOの生物学的利用能を高めることを目的とする。

【方法】SLPは、基剤としてハードファットを用い、界面活性剤としてTween60およびポリビニルアルコール(PVA)を用いて調製した。さらに、エチルセルロース10あるいは45(EC10、EC45)を添加したものについても調製した。SLPの調製において、PVAの添加が粒子径に及ぼす影響について評価した。さらに、けん化度および粘度の異なるPVAを用い、特性値の異なるPVAがSLPの封入効率、粒子径および粒度分布に及ぼす影響について評価した。

【結果・考察】PVAを添加しないSLPにおいては針状結晶がみられたが、PVAを添加することで球状の微粒子となることが確認された。PVAの添加量については添加量を増加させると、封入効率が向上する結果が得られた。PVAの特性値の影響については、ECを含まないSLPにおいては、けん化度および粘度が低いPVAにおいて良好な粒度分布が確認された。ECを含むSLPについては、PVAの添加量が高い場合、粘度が高いPVAにおいて粒度分布が良好となり、添加量が高い場合は、粘度の低いPVAにおいて良好な粒度分布となる結果が得られた。PVAの添加量および特性値は、SLPの封入効率、粒子径および粒度分布に影響を及ぼす結果が得られたことから、SLPの組成によって最適なPVAの添加量および特性値があることが示唆された。