

27AB-pm102

エレクトロスピンニング法を用いたアセトアミノフェンナノファイバー錠剤の調製とその製剤評価

○永野 茄奈¹, 芝田 信人¹, 西村 亜佐子¹, 羽森 真美¹, 柿本 早香¹, 加茂 友起乃¹, 北澤 加奈¹ (¹同志社女大薬)

【目的】エレクトロスピンニング (ES) 法は、ニードル先端に高電圧を印加し高分子ポリマー溶液を吐出させ、溶媒を瞬時に揮発させナノファイバー (NF) を形成する技術であり、繊維分野での技術開発が行われてきた。今回、ES 法を医薬品分野に応用し、薬物含有 NF を創製すると共に、NF を放出支持体として利用したアセトアミノフェン (AAP) 放出制御型錠剤を設計し、製剤学的検討を行った。

【実験方法】高分子にメタクリル酸コポリマー-S (EUDRAGIT®S100 : MAC) をモデル薬物に AAP を用い、ES 法により AAP 含有 MAC-NF を創製した。捕集した NF を直接打錠法により打錠し、以下の 3 種類の被験製剤を調製した。a) AAP 全量を NF 中に含有させた製剤 (NFT); b) AAP 全量を薬物非含有 NF に吸着させた製剤 (NFT_{adso}); c) AAP 半量を NF 中に含有させた後、残りの AAP 半量を吸着させた製剤 (NFT_{half})。また、コントロール製剤として、AAP と製剤添加物の単純混合物を打錠して調製した (PMT)。In vitro 溶出試験及びラット in vivo 十二指腸投与試験を実施し、AAP の溶出挙動と体内動態を検討した。In vitro では、製剤の溶出特性の評価として、打錠圧及び溶出相の pH 変化が溶出挙動に及ぼす影響についても検討した。

【結果・結論】薬物含有 NF の打錠は滑沢剤を使用せず実施でき、打錠障害は認められなかった。In vitro 溶出試験では、打錠圧及び溶出相の pH 変化に依存した AAP の徐放特性と pH 依存性の緩慢な浸食作用による放出挙動を確認した。一方、ラット in vivo 十二指腸投与試験では、AAP の NF 錠剤は長時間持続の徐放性とバイオアベイラビリティの向上が確認された。さらに、AAP の NF への添加形態の違いにより薬物の溶出挙動を制御できる事も確認した。ES 法による NF は、徐放制御型製剤の設計に有用であり、DDS 設計において幅広い応用性を有するものと考えられた。