

25F-am02S

2種類の高分子を用いた薬物高含有機能性中空粒子の設計

○大杉 祐貴子¹, 吉原 尚輝¹, 浅田 拓海², 木村 晋一郎¹, 岩尾 康範¹, 野口 修治³, 板井 茂¹ (¹静岡県大薬, ²大日本住友製薬, ³東邦大薬)

【目的】近年、薬物と薬物の5倍以上の粒子径を持つ高分子の混合粉体を高分子可溶性の溶媒を用いて湿式造粒することにより、内部に一つの大きな空隙を有する薬物含有中空粒子を調製できることが報告された。本手法により、球形度が高く薬物高含有な粒子を簡便に調製できることから、様々な医薬品への応用が期待される。また、使用する高分子の選択によって所望の機能性を粒子に付与できるため、機能性粒子の調製方法として有用であると考えられる。そこで本検討では、水溶性および水不溶性の二種類の高分子を用いることで、フェニトイン含有徐放性中空粒子の調製を試みた。

【方法】薬物としてフェニトイン (PHT; $d_{50} = 7 \mu\text{m}$), 高分子としてヒドロキシプロピルセルロース (HPC; 149–250 μm 画分) およびエチルセルロース (EC; $d_{50} = 5.7 \mu\text{m}$) を用いた。造粒溶媒として水または 70v/v%エタノールを用い、多機能型遠心転動造粒装置 Granurex[®] (フロイント産業株式会社) にて PHT 70%含有中空粒子を調製した。調製した粒子について粒子物性 (薬物含有率, 粒度分布, 流動性, 粒子硬度, 球形度, 粒子形状) および薬物放出挙動を評価した。

【結果・考察】調製した PHT 含有粒子は粒度分布幅が狭く、優れた流動性を示した。また、高い硬度と球形度を示し、中空構造を有していた。さらに、70v/v%エタノールを造粒溶媒として用いることで、粒子に薬物放出制御能が付与された。また、HPC と EC の配合比を変化させたところ、EC 比の増加に伴い、粒子からの薬物放出は強く抑制された。本研究は、種々の高分子を用いた機能性中空粒子の設計における重要な基礎的知見となるものと考えられる。