

27PB-pm127

タンニン酸を含むコンスターチベースの OD 錠用プレミックス賦形剤の設計

○石川 学¹, 近藤 啓太¹, 山田 篤志², 島谷 隆夫², 丹羽 敏幸¹ (¹名城大薬, ²テイカ製薬株式会社)

[目的] 高齢者、小児、嚥下困難の患者などが服用しやすく、少量の水で容易に服用できる口腔内崩壊錠 (OD 錠) が一般剤形として認知されるようになってきた。水溶性結合剤とタンニン酸を組み合わせる製剤技術「howatt」を利用し、高い圧縮成形性を保持しつつ、速やかな吸水性・崩壊性を示す OD 錠の設計を提案した。本研究では当該技術を応用し、コーンスターチとタンニン酸を組み合わせた新規な OD 錠用プレミックス賦形剤の設計を検討した。

[方法] コーンスターチを流動層造粒機 (アグロマスタ、ホソカワミクロン) で造粒した。結合液には、ヒドロキシプロピルセルロース (HPC) 水溶液およびタンニン酸 (TA) 水溶液を用いた。製した顆粒を万能圧縮引張試験機 (AG-5000、島津製作所) にて 500~1000kgf で圧縮成形し、質量 200mg、直径 8mm の円形平型錠剤を調製した。得られた錠剤について硬度試験、局方崩壊試験、in vitro 口腔内崩壊試験 (トリコープテスター、岡田精工) を実施し OD 錠としての物性を評価した。さらに、吸水膨潤試験による崩壊メカニズムの解明を行った。

[結果・考察] HPC 造粒物より得られた錠剤は、実用上十分な硬度 (50N 以上) を有していたが、in vitro 口腔内崩壊時間が平均 118 秒と崩壊が極めて遅かった。そこで、HPC 造粒物に TA 水溶液をスプレーコーティングした HPC-TA 造粒物を調製した。この造粒物より得られた錠剤は HPC 造粒物よりも速やかな吸水性を示したが、崩壊性の向上には至らなかった。一方、TA 造粒物より得られた錠剤は、50N 以上の高い硬度と in vitro 口腔内崩壊時間が平均 6 秒を示したことにより、優れた硬度と崩壊性を両立できることが明らかになった。発表では、TA 造粒物から成る錠剤の崩壊メカニズム、および OD 錠への適用性について併せて報告する。