

天然物由来成分を主薬とする製剤の処方設計に関する研究

がんゆう こうくうない そくほうかいじょう せいざいせつけい

キハダ含有口腔内速崩壊錠の製剤設計

キハダはオオバク又はオウバクと称され、古来より整腸作用の強い苦味健胃薬として汎用されています。しかし、特有の強い苦味と特異な臭いがあり、市販製剤においても臭いや味が良くないことから服用が敬遠される傾向があります。

本研究では、服用しやすい医薬品製剤に関する研究の一環として、キハダの苦味軽減化の方法及び苦味を軽減した製剤の製造方法を検討し、キハダを含有する口腔内速崩壊錠を試作しました。

■ 苦味の軽減化方法の検討

① 添加物の検討

酸及び苦味の隠蔽や軽減に有効と思われる物質をキハダ末に添加しました。検討した結果、ココア末とアスパルテームの添加が苦味の軽減化に有効であることがわかりました。

② 微細造粒化の検討

ココア末をキハダ末に微分散化することが苦味の軽減化に効果的であることから、微分散化した顆粒の調製方法を検討しました。ココア末懸濁液をキハダ末に噴霧する方法、キハダ末とココア末を練合する方法により、キハダ末含量71%の苦味を軽減化した顆粒を得ることができました。

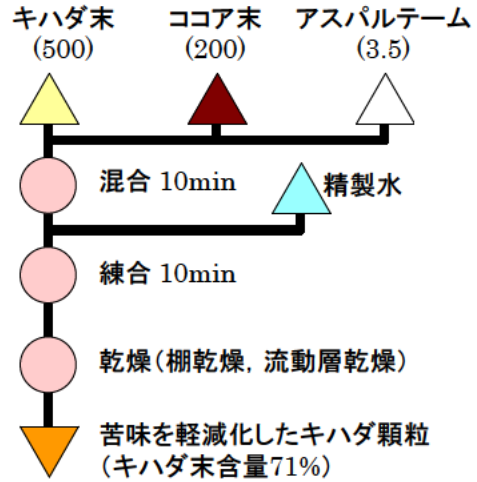


図1 苦味を軽減化したキハダ顆粒の調製方法

■ キハダ含有口腔内速崩壊錠の試作

① キハダ含有錠剤の試作

目標: 崩壊時間3分以内

ココア末懸濁液をキハダ末に噴霧した顆粒、賦形剤に口腔内速崩壊錠組成(乳糖/マンニトール/カルメロース)を使用し、練合法により錠剤成形用顆粒を調製し、錠剤を試作しました。

苦味を軽減化したキハダ顆粒を50%使用(キハダ末含量35%)して、崩壊時間166秒、良好な味、外観の均一な錠剤を得ることができました。

② 積層錠化による崩壊時間の短縮

キハダ含有錠剤を2層化、3層化することにより、崩壊時間をさらに短縮することを試みました。錠剤は2層錠、3層錠ともに各層同重量で成形しました。

積層錠化により、2層錠 77秒、3層錠 60秒まで崩壊時間を短縮した錠剤を得ることができました。

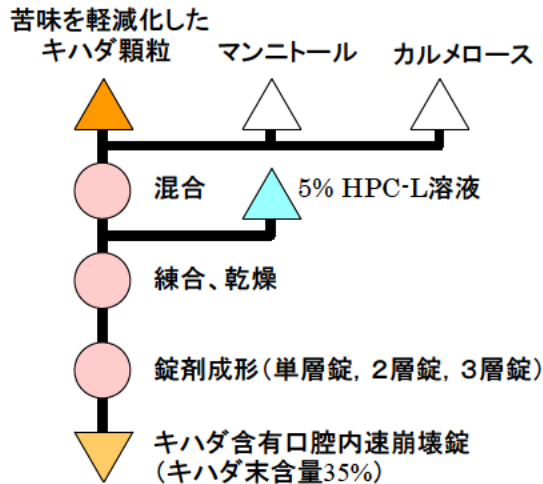


図2 キハダ含有口腔内速崩壊錠の製造方法

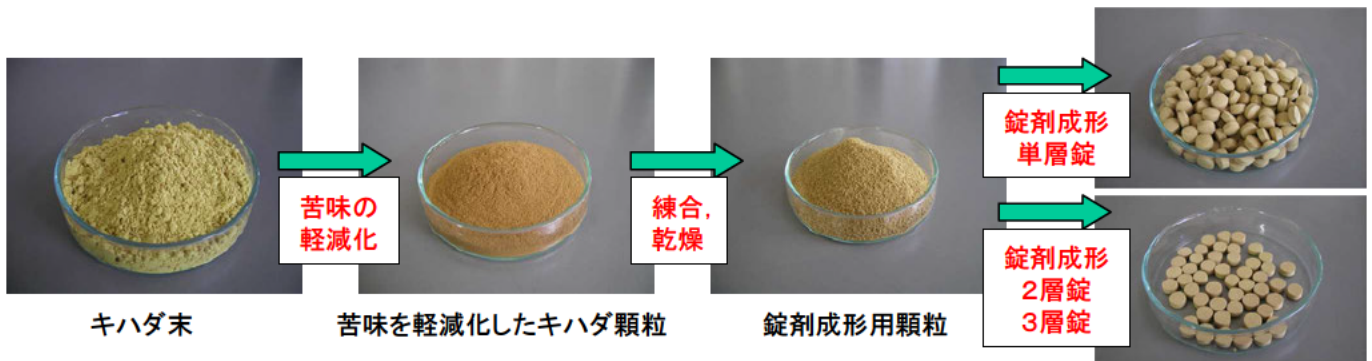


図3 キハダ含有口腔内速崩壊錠の製造工程の流れ

キハダ含有口腔内速崩壊錠