

これまで4回にわたって述べてきました錠剤加工の連載も最終回となりました。今回は、「錠剤の役割、それは？」と題して、錠剤形状の品質(錠剤硬度、崩壊時間、有効成分の溶け出し方である溶出時間)管理について、実験データを交えながら紹介します。“製剤の達人”に認定された先生方は、“良い錠剤を造るには、良い打錠用顆粒を造ること”と話されますが、どういう事なのでしょう。

### 固まりやすくなったウコン粒は良い錠剤？

前回述べましたように、固まりにくい秋ウコンは造粒によって固まりやすくなります。<sup>1)</sup>錠剤化するための“良い顆粒”となったわけです。しかし、それだけでは“良い錠剤”とは言えません。体内の胃や腸で崩壊、更には有効成分が溶出しなければ、その機能を発揮することはできません。ではどうしたら、崩壊性や溶出性を管理する事ができるのでしょうか？

### 固まったウコン粒をもろくするには？

錠剤の崩壊性を制御する方法は幾つかあります。一つは崩壊剤を顆粒と一緒に混ぜて錠剤化する方法です。一般的には膨潤剤や溶解剤等を使用します。また、“良い打錠用顆粒”を造ることから考えるのも一つの手です。例えば図1に示しますように、秋ウコンを95%、ヒドロキシプロピルセルロース(HPC)を5%にして流動層造粒を行う場合、HPCの分子量によるグレードを組み合わせることで、5kgf以上の錠剤硬度を保ちながら崩壊時間の制御ができます。

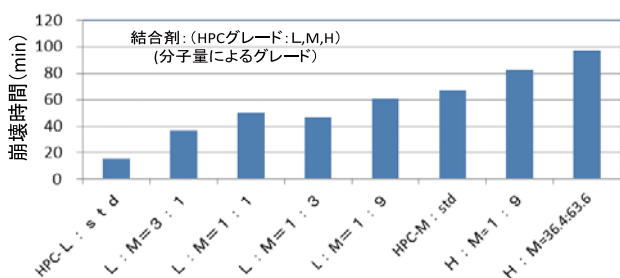


図1. HPCグレード(L,M,H)の組み合わせと崩壊時間

### 固まったウコン粒のクルクミンは溶ける？

このようにして、胃や腸で崩壊するような錠剤品質までになりました。しかし実は、未だ十分では無いのです。崩壊したウコンから本当に有効成分が溶け出し吸収されなければ、真の意味で“良い錠剤”とは言えません。

溶出性制御の主な方法は、粉末の微粉化や造粒技術等が挙げられます。例えば、HPCグレードを組み合わせることで、崩壊時間だけでなく、クルクミンの溶出時間も制御できました(図2)<sup>2)</sup>。クルクミン溶出率が90%になる溶出時間を20分から120分まで制御できます。

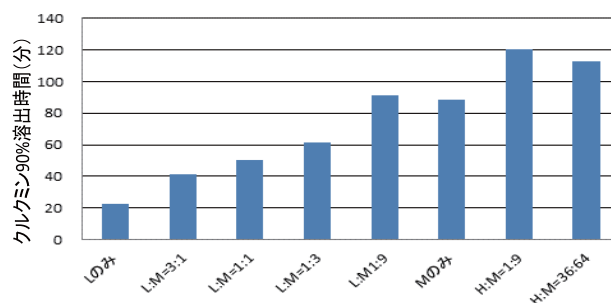


図2. HPCの組み合わせとクルクミン溶出時間

錠剤の役割は、摂取されるまで形状を保っている事、胃や腸で崩壊する事、更には成分が溶出して吸収されることと多岐にわたっています。

造粒技術は、固まりにくい秋ウコンを錠剤化するだけではなく、崩壊性や、更にはクルクミンの溶出性も錠剤の役割(品質)として管理することができ、商品企画を満足させることができるのです。

医薬品では必須である錠剤の崩壊や溶出を制御する事は、これからの健康食品分野の重要な技術要素の一つになると思われます。現に、機能性表示食品の錠剤形態(粒)製品の品質管理項目の中には、錠剤硬度だけではなく、崩壊時間も推奨されているからです。

5回連載の「錠剤加工技術」、県内業界の皆様にも少しでもお役に立てて頂ければ光栄です。

### 参考文献

- 1) 第30回製剤と粒子設計シンポジウム講演要旨集 P. 122-P123 (2013)
- 2) 第31回製剤と粒子設計シンポジウム講演要旨集 P. 120-P121 (2014)