

1. 概要

D-マンニトールの優れた安定性に着目し、新たに製剤用球形粒ノンパレル[®]-108 (NP-108) を開発した。NP-108 の特長、薬物との反応性およびサスペンションコーティングに関する実験について紹介する。

2. 趣旨

NP-108 はD-マンニトール 100 %の球形粒である。結晶を造粒して核粒子とした後、微粉碎した粉末のレイヤリングをおこなうことで、D-マンニトールの球形化に成功した (図)。従来のノンパレルシリーズの長所である、真球度の高さや粒度分布のシャープさに加えて、NP-108 は組成に起因した、①高い安定性、②自由水をほとんど持たない、③低カロリーという優れた特長を有している。

NP-108 では、他のノンパレルには無い、平均粒子径が約 200 μm と小さいグレードを用意しており、様々な製剤に使用可能である。

【注釈：出典には無いが 100 μm の製品も上市している。】

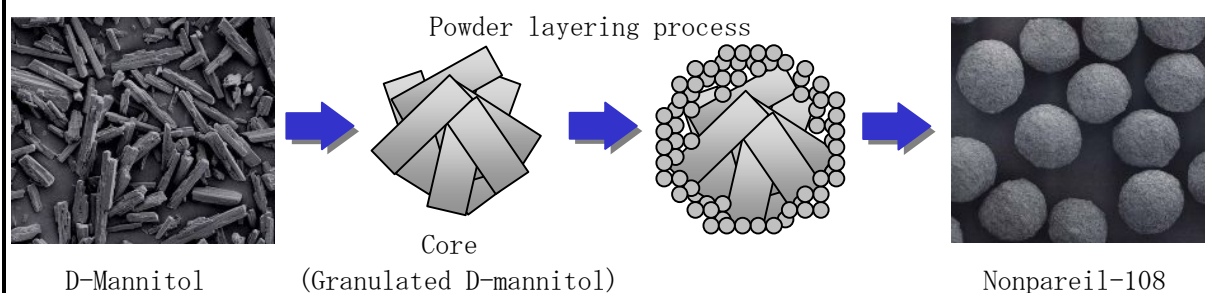


図 ノンパレル-108 の造粒イメージ

モデル薬物としてアミノフィリンを用い、NP-108、NP-103 (精製白糖球状顆粒)、結晶セルロース粒へ粉末レイヤリングを行った。得られた顆粒を 40°C75%RH の条件で 1 ヶ月間保存し、経時的な着色の差異を色差測定により評価した。NP-103 と結晶セルロース粒を用いた場合には、保存期間の延長に伴い顆粒への経時的な着色が認められた。それに対し NP-108 を用いた顆粒では、経時的な着色は僅かであった。

エテンザミドを用いた NP-108 (200) グレードへの水系サスペンション薬物コーティングを行った。得られたコーティング顆粒のコーティング率および凝集発生率は、それぞれ 96.0 % および 1.8 % であった。コーティングによる凝集の発生はほとんど無く、収率良くコーティング顆粒が得られている。

詳しくお知りになりたい方は弊社にお問い合わせいただくか、下記文献を御覧になって下さい。

出典 田内郁男：製剤機械技術研究会誌、16, 210 (2007)