

## 直接打錠用賦形剤 パーファイラー<sup>®</sup>-101

パーファイラー-101(以下 PF-101)は、医薬品添加物規格「合成ケイ酸アルミニウム・ヒドロキシプロピルスターチ・結晶セルロース」に該当するプレミックス添加剤であり、賦形剤、結合剤及び崩壊剤の機能を兼ね備えたオールインワンの添加剤です。本品は、合成ケイ酸アルミニウム(日局)の懸濁液にヒドロキシプロピルスターチ及び結晶セルロース(日局)を加えて噴霧乾燥したものです。

### 《物性》

#### 組成

合成ケイ酸アルミニウム	約 20%
ヒドロキシプロピルスターチ	約 60%
結晶セルロース	約 20%

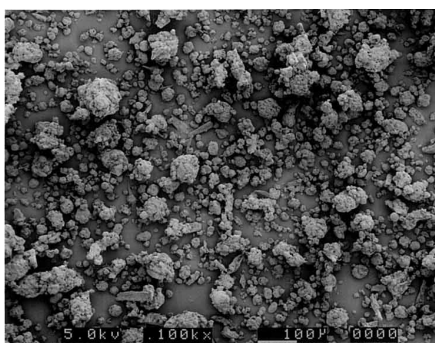
#### 流動性

PF-101 の流動性は、各構成成分単独あるいはそれらの物理的混合物に比べ、良好です。

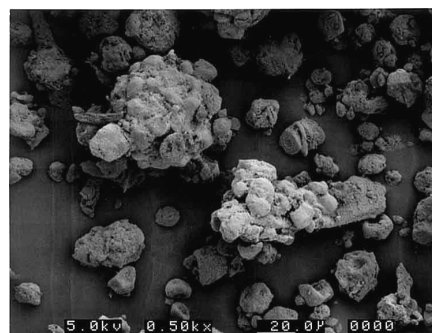
		平均粒子径	流動性指数
構成成分	合成ケイ酸アルミニウム	2.8 $\mu\text{m}$	40.5
	ヒドロキシプロピルスターチ	12.9 $\mu\text{m}$	42.0
	結晶セルロース	40.0 $\mu\text{m}$	51.0
物理的混合物		—	48.5
<b>PF-101</b>		<b>47.2 <math>\mu\text{m}</math></b>	<b>71.5</b>

※ 流動性指数は、4 項目(安息角、圧縮度、スパチュラ角、均一度あるいは凝集度)の測定値から求めた各指数の合計値です。流動性指数が大きいほど、流動性は良好です。

### SEM 写真



— 100  $\mu\text{m}$



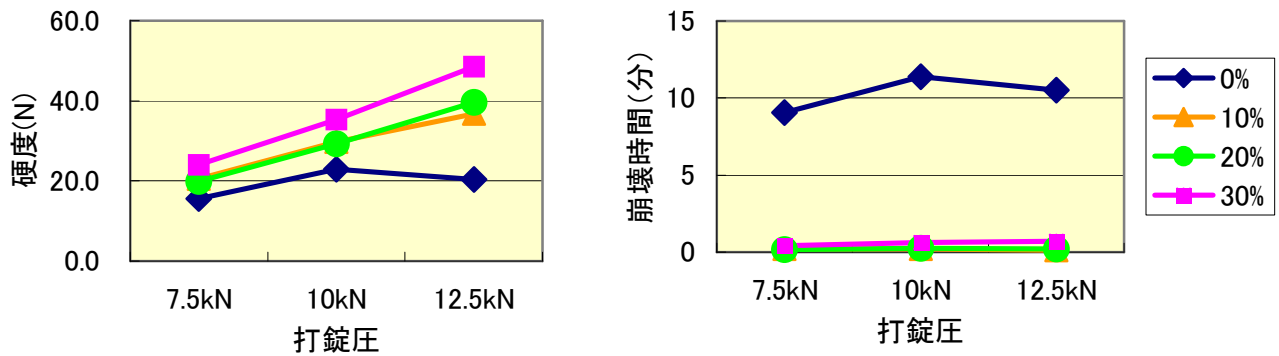
— 20  $\mu\text{m}$

《特長》

◆ 崩壊性に優れる

- ・ 100M 乳糖への添加

100M 乳糖をベースに PF-101 を 0～30% 添加した処方にて、打錠圧を 7.5、10、12.5kN の 3 水準で製した錠剤の硬度と崩壊時間を下のグラフに示します。  
PF-101 添加により、硬度は上昇し、崩壊時間は無添加で 9 分以上であったところ、1 分以内にまで短縮されました。



◆ 成形性に優れる

- ・ 成形性の悪い粉体 (アスコルビン酸、マンニトール) への添加

成形性の悪い粉体を多く含む処方にて打錠を行ったところ、PF-101 添加により、打錠障害が改善され、崩壊性に優れた錠剤を得ることができました。

	アスコルビン酸錠		マンニトール錠	
	0%	15.0%	0%	15%
PF-101	0%	15.0%	0%	15%
アスコルビン酸	40.0%	40.0%	—	—
ダイラクトーズ S	59.5%	44.5%	—	—
マンニトール造粒品 <sup>※1</sup>	—	—	99.0%	84.5%
ステアリン酸マグネシウム	0.5%	0.5%	1.0% <sup>※2</sup>	0.5%
打錠圧	15kN	15kN	12.5kN	15kN
キャッピング	あり	なし	なし	あり
崩壊時間	—	<30 秒	7 分	45 秒

※1 転動流動造粒品、バインダーとしてヒドロキシプロピルセルロース (HPC-L) を使用

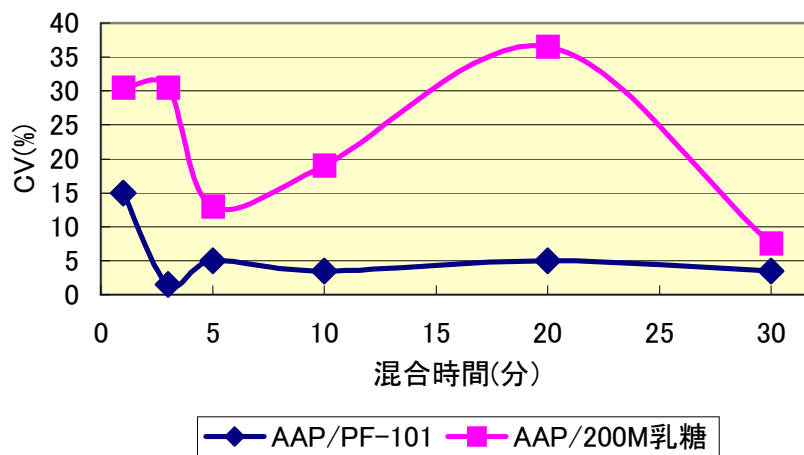
※2 0.5% 添加ではスティッキングにより打錠不可であったため、1.0% 添加

◆ **混合性が良好であり、主薬の分散媒として有効である**

- ・ アセトアミノフェンの混合例

PF-101 にアセトアミノフェン (AAP) 1% を添加し、下の条件にて混合すると、3 分ほどで安定した均一分散末を得ることができます。

混合機                    寿ミックスウェル V-10 型混合機 (徳寿工作所)  
 容積、仕込量            22L、4kg (AAP:PF-101 or 200M 乳糖=1:99)  
 回転数                    36rpm



◆ **流動性改善効果を示す**

- ・ オウバク乾燥エキスへの適用例

オウバク乾燥エキスに PF-101 を添加混合すると、混合末の流動性が改善されます。この流動性改善により、散剤あるいは直接打錠による製剤化が容易になります。

オウバク乾燥エキス	100%	90%	80%
PF-101 添加量	0%	10%	20%
流動性指数	46.0	51.0	57.5