

第 15 回オイドラギットセミナー 講演内容

「コントロールリリース製剤 –新しい技術と QOL 向上–」

講演 1: 多孔性球状シリカを用いた微粒子コーティング法による機能性粒子の品質確保と製造性の改善 ～オイドラギット® E PO を用いたケーススタディー～

石田誠 先生 / 日本たばこ産業株式会社 生産技術研究所

昨今、苦味マスキングなど機能性粒子の加工技術への要望が高くなっている。機能性粒子の製造技術である微粒子コーティング法は、粒子同士の凝集が発生し、付与した機能性が損なわれるリスクや製造時間の延長などの欠点を有する。本講演では、多孔性球状シリカを新規核粒子として適用し、その特性を紹介するとともに、粒子の凝集抑制やオイドラギット® E PO を用いた機能性コーティング皮膜の品質確保及び製造性の改善について紹介したい。

講演 2: オイドラギット® E ポリマーを用いたユリーフ®OD 錠の製剤設計

柴田雄亮 先生 / キッセイ薬品工業株式会社 CMC 研究部 製剤研究所

有効成分であるシロドシンは熱・湿度に不安定であり、また強い苦味を有している。OD 錠製剤化に向けて処方及び製法を鋭意検討した結果、アミノアルキルメタクリレートコポリマー-E を用いることでシロドシンの安定化並びに苦味を抑制できることを見出した。本講演では、当社が開発したユリーフ®OD 錠について紹介する。

講演 3: Drug delivery technologies for transcellular and paracellular bioavailability enhancement

Hans Bär / Evonik Nutrition&Care GmbH, Head Global Drug Delivery Orals

The growing number of NCEs coming out of drug discovery with limited permeability and/or poor solubility is becoming an increasing challenge for formulation scientists. Such properties may hinder to exploit the drugs' full pharmacodynamics potential. In response to market needs to enhance permeability and thus enable higher bioavailability, Evonik has recently developed novel drug delivery concepts for BCS3 and BCS4 compounds that are designed to modify transcellular and paracellular uptake pathways. The presentation will first introduce an innovative transfection enhancer associated with drug loaded PLGA nanoparticles to mediate uptake of intact API matrix PLGA particles, and demonstrate benefits such as plasmid expression in epithelial cells. This concept could already be utilized for compounds at drug discovery stages. To modify the paracellular uptake, Evonik has developed a multiparticulate formulation concept demonstrating 7-fold AUC increases, translating to potential dose reductions of up to 80%. Both innovative formulation concepts utilize common manufacturing processes, and do not modify APIs by covalent bonds. The proprietary transfection enhancer has not shown any negative immune stimulation or toxicological effect.

講演 4: シンプルな粒子設計による口腔内崩壊錠の設計

谷村信爾 先生 / 協和発酵キリン株式会社 CMC 研究センター 製剤グループ

口腔内崩壊錠は嚥下困難な患者への容易な投与形態として開発され、服薬アドヒアランスの向上、経管投与における簡易懸濁法への適用等の有用性が認められている。口腔内崩壊錠の製造法は、高効率化（低コスト化）や品質管理の容易さの点から、新規な添加剤を使用せず、シンプルな製造工程が好ましい。本講演では、多孔性シリカを担体とした添加剤の複合粒子化や EUDRAGIT® を利用した口腔内崩壊錠設計の事例を紹介する。