

健康食品の製剤化における課題解決ーバレリアン根エキス

健康食品の処方

健康食品の有効成分の含量は高く、物理化学的性質にも問題があるために、直接打錠法は一般的に難しいといわれている。代表的な課題としては：

- 有効成分が環境の湿度、熱および光に対する安定性が低い
- 粉末の流動性や圧縮成形性が悪い
- 同一処方中に含まれる複数の有効成分間での相互作用
- 有効成分の強い匂いや苦味

したがって、最終製剤の製造工程および安定性目標を達成するために、処方設計の段階で有効成分の特性を考慮し、処方の物性を改善する適切な賦形剤を選択する必要がある。



本研究の目的

バレリアン根エキスは、不安および不眠症の軽減効果を期待して健康食品として広く服用されている¹⁾。そのエキス末は水には不溶性で、吸湿性があり流動性は非常に悪いため、高用量が含まれる処方では圧縮性が著しく低い問題が生じる。また、原料は供給元によっては不快な臭いを有する。そこで、本研究では、直接打錠用にデザインされたスターチStarTabを用いて、バレリアン根エキスの処方設計と製造工程を簡略化し、フィルムコーティング後のバレリアン根エキス錠の崩壊性を確認することとした。

原料および方法

バレリアン根エキス300mg含有の錠剤を直接打錠法で製造した。

滑沢剤を除く処方1 kgバッチ（表1）すべての成分を10分間混合し、ステアリン酸マグネシウムを加え、更に3分間混合した。賦形剤として、StarTabと結晶セルロース(Avicel 102, Dupont)を2:1の比率で添加した。そして、13/32"(10.3mm)の標準円型凹面Bタイプ杵臼で、10kN主圧（打錠圧）で打錠した。次に、12"通気型コーティングパン(O'Hara Labcoat II)で青色のNutrafinishを用いて素錠を3%（質量増加w/w）までコーティングした。コーティング工程条件を表2に示す。

表1: バレリアン根エキス錠の処方組成

	% w/w	mg/錠
バレリアン根エキス	50.00	300.00
StarTab	32.67	196.02
結晶セルロース(90 μ m)/ Avicel 102	16.33	97.98
ステアリン酸マグネシウム	1.00	6.00
錠剤質量	100.00	600.00

表2: Nutrafinishフィルムコーティング工程条件

固形成分濃度 (%)	25
パン回転速度 (rpm)	13
給気風量 (CFM)	137
噴霧空気圧 (psi)	20
パターン空気圧 (psi)	20
スプレー速度 (g/min)	8-10
給気温度 (°C)	59-61
排気温度 (°C)	37-41
製品温度 (°C)	32-40

結果

StarTabの添加により粉末物性が改善され、直接打錠法に適したバレリアン根エキス処方となった(表3)。混合粉末は容易に圧縮され、良好な物性を有する錠剤が得られた。表4は、コーティング前後のバレリアン根エキス錠の錠剤物性である。錠剤はフィルムコーティング後に、表面が滑らかな光沢のある錠剤となった(図1)。崩壊試験の結果、いずれの錠剤も30分未満で完全に崩壊し、USP規格²に適合した(表4)。溶出試験は、定量試験法が確立されていないため実施しなかった。

表3: 粉末の物性比較

物性	バレリアン根エキス末	打錠用混合粉末末
かさ密度 (g/mL)	0.49	0.53
圧縮度 (%)	33.80	21.51
粒子径 d50 (μ m)	47.69	79.40
流動性評価	極めて悪い	流動が可能

表4: バレリアン根エキス速放錠の物性

物性	素錠	コーティング錠
質量 (mg)	604.31 \pm 4.33	627.30 \pm 5.60
厚さ (mm)	7.80 \pm 0.01	7.76 \pm 0.02
硬度 (kP)	14.21 \pm 0.74	18.60 \pm 1.30
摩損度 (%)	0.0 \pm 0.0	0.0 \pm 0.0
崩壊時間 (分)	18.53 \pm 1.93	18.68 \pm 1.08

図1: バレリアン根エキスコーティング錠



結論

直接打錠用スターチStarTabの添加によって、粉末流動性と圧縮成形性を改善し、バレリアン根エキス速放錠の処方化および製造工程の簡略化に成功した。フィルムコーティングプレミックスNutrafinishで素錠をコーティング後は、光沢が高い滑らかな外観仕上がりを達成した。

StarTabは粉末処方の流動性と圧縮性の課題を解決します

吸湿性の高い成分を含む粉末処方の流動性を改善し、直接打錠法による開発・製造をサポートします

直接打錠用スターチStarTabの利点：

- 流動化剤およびスーパー崩壊剤の添加が不要
- 優れた流動性により粉末混合性、錠剤質量のバラツキを改善
- 錠剤の圧縮成形性、崩壊性を同時に達成
- 処方と製造工程の簡略化が可能

参考文献

1. Bent, S., Padula, A., Moore, D., Patterson, M., Mehling, W. 2006. Valerian for sleep: a systematic review and meta-analysis. Am J Med. 119(12), pg. 1005-1012
2. USP 32 – Dietary Supplements I <2020> Disintegration and Dissolution of Dietary Supplements

The information contained herein, to the best of Colorcon, Inc.'s knowledge is true and accurate. Any recommendations or suggestions of Colorcon, Inc. with regard to the products provided by Colorcon, Inc. are made without warranty, either implied or expressed, because of the variations in methods, conditions and equipment which may be used in commercially processing the products, and no such warranties are made for the suitability of the products for any applications that you may have disclosed. Colorcon, Inc. shall not be liable for loss of profit or for incidental, special or consequential loss or damages.

Colorcon, Inc. makes no warranty, either expressed or implied, that the use of the products provided by Colorcon, Inc., will not infringe any trademark, trade name, copyright, patent or other rights held by any third person or entity when used in the customer's application.

For more information, contact your Colorcon representative or call:

North America	Europe/Middle East/Africa	Latin America	India	China
+1-215-699-7733	+44-(0)-1322-293000	+54-1-5556-7700	+91-832-6727373	+86-21-61982300

You can also visit our website at www.colorcon.com



© BPSI Holdings LLC, 2020.

The information contained in this document is proprietary to Colorcon and may not be used or disseminated inappropriately.

All trademarks, except where noted, are property of BPSI Holdings, LLC.

ads_2020_StarTab_valerian