

打錠特性新規評価システムの構築と処方設計への適用 (1)

Establishment of a New Evaluation System for Tableting Properties and Its Application to Formulation Design of Tablets (1)

長村 崇史

Takashi OSAMURA

沢井製薬株式会社 研究開発本部 技術部 製剤技術グループ

Pharmaceutical Technology Group, Pharmaceutical Technology Department,
Research & Development Division, Sawai Pharmaceutical Co., Ltd.

■ 要旨

商業生産では錠剤はロータリー打錠機を用いて大量生産されるが、打錠障害が発生すると安定的に生産できない。打錠障害を回避するためには、粉体の打錠特性を理解した上で処方設計すべきである。本研究では、多機能性打錠評価装置を用いた打錠特性の新規評価システムの構築と処方設計への適用を提案した。本評価システムの特徴は、粉体圧縮性の指標に粉体の弾性回復率を、圧縮成形性の指標に錠剤の強度 (TFS) を、そして製造性の指標に錠剤の排出圧 (ES) を用いることである。さらに、TFS および ES を組み合わせ、圧縮成形性および製造性の特徴を四つの領域に分けることにより、打錠特性が視覚的に表現される。医薬品添加剤や錠剤処方の打錠特性を定量的に測定でき、処方設計において添加剤の種類や配合量を決定する際に活用できる。さらに、滑沢剤の混合時間の変動に伴う打錠特性への影響についても定量的な評価が可能である。

■ Abstract

In commercial production, tablets are mass produced by using a rotary tablet press. However, if tableting failure occurs, stable production is impossible. To avoid tableting failures, the formulation should be designed after understanding the "Tableting Properties" of the powder. In this research, the build of a new evaluation system for them by using a benchtop single-punch tablet press and its application to formulation design are proposed. The characteristics of this evaluation system are that the elastic recovery of the powder is used as an index of "Compressibility", the tensile fracture stress of the tablet (TFS) is used as an index of "Compactability", and the ejection stress of the tablet (ES) is used as an index of "Manufacturability". In addition, by combining TFS and ES and characterizing the "Tableting Properties" into four regions, they are visually represented. This evaluation system can quantitatively measure the "Tableting Properties" of excipients and tablet formulations and can be used in determining the type and amount of excipients in the formulation design. Furthermore, it is possible to assess the impact of the blending time of the lubricant on the "Tableting Properties quantitatively".

■ Keywords ■ tableting properties, compressibility, compactability, manufacturability, formulation design, plot way