

難水溶性物質の製剤化と *in vitro* 吸収性評価 日本薬剤学会 2019 年度大会(富山)で発表

太陽化学株式会社(本社:三重県四日市市)は、2019年5月16(木)~18日(土)富山国際会議場、富山市民プラザにて開催される日本薬剤学会 第34年会において「難水溶性物質の製剤化と *in vitro* 吸収性評価」についてポスター発表します。

食品機能性素材の製剤化において、有効性を発揮させるために吸収性を高めることは重要な目的のひとつです。従来、吸収性の評価手法は動物試験が中心でしたが、腸内環境を想定した *in vitro* 評価技術によって、食品機能性素材や製剤の吸収効率を評価できる可能性が示唆されました。今後も当社は製剤化技術(NDS™技術※)について更に研鑽し、世界の人々の健康と豊かな生活文化への貢献を目指します。

※NDS™技術; Nutrition Delivery System, 機能性素材が抱える特有の問題(安定性、吸収性等)を独自の製剤化技術として進化させ、さまざまな食品形態に応用可能で、効率よく私たちの体に届けることのできる付加価値を高める基盤技術です。

ポスター番号:P3-62

発表演題:「難水溶性物質の製剤化と *in vitro* 吸収性評価」

○富永悦子、杉原由香、福原寛央、小関誠、中村武嗣

【背景・目的】難水溶性物質の経口吸収性の低さや個体間変動は重要な課題であり、製剤化による改善が期待される。本研究は、難水溶性物質の経口吸収性に対する製剤化の効果を評価するため、簡便な *in vitro* 評価系を構築することを目的とした。我々は、難水溶性物質の中でも非攪拌水層律速となりうる物質に対し、バイオアクセシビリティ(消化管内における吸収可能な可溶化状態の割合)は有効な評価指標になると仮定し検討を行った。さらに、*in vivo* での評価結果と比較することで本評価系の信頼性について検証した。

【方法】Lutein(LogP11、融点 196°C)、Coenzyme Q10(LogP19.4、融点 50-52°C)等を基材とし、食品用乳化剤を用いて各種粒子径の可溶化溶液製剤および結晶製剤を調製した。本製剤について、胃と腸での消化を想定した *in vitro* 系(ブタ由来の胆汁、消化酵素使用)で消化試験を行い、全量に対する混合ミセル中に可溶化された物質の割合を算出した。

【結果・考察】原体に対し何れの製剤でもバイオアクセシビリティの上昇が認められた。また、

結晶製剤に対し可溶化溶液製剤は有意な上昇が確認された。さらに、粒子径を微細化することによって上昇傾向が認められた。これら結果は、ラット(SD系雄、9-14週齢)を用いた単回投与試験における血中濃度(AUC)と良好な相関関係を示した。以上の結果より、本研究で用いた *in vitro* 評価系は結晶状態や粒子径が異なる製剤の経口吸収性を推測できる可能性が示唆された。また現在、食事の有無や個体差に対する製剤の影響についても本 *in vitro* 系による評価可能性を検討しているため、併せて報告する。