

錠剤化のための 添加剤の開発と利用

編集部

サプリメントに必要な添加剤の条件

わが国のサプリメント市場は、表示や販売についての規制強化と経済悪化を受け、06年～09年は市場が落ち込んだが、2010年はプラスに転じ12年から13年はさらに好調な動きを示している。

錠剤、カプセルなどの形状が早くから食品の形状として認められていた米国では、食生活の中に錠剤・カプセルが根づいているが、わが国では永年、薬事法の監視のもと医薬品的な形状は食品としては認められておらず、規制も厳しかった。このような状況が01年の「医薬品の範囲に関する基準」の改正後変わり、「食品」である旨が明示されている場合、錠剤、丸剤はもちろん、ソフトカプセル、ハードカプセルの利用も自由になり、実質上の形状規制がなくなった（アンプル形状除く）。中でも最も広く利用されているのが錠剤だ。

錠剤を作る添加剤としては賦形剤、コーティング剤、滑沢剤、崩壊剤などがあり、これら添加剤の処方で成形性、流動性、崩壊性などのコントロールや、さらに腸溶性などの高機能製剤をつくることができる。

食品での錠剤製造において医薬品との最大の違いは、医薬品では薬効成

分が極少量なのに対し、食品ではできるだけ目的成分を高含有化することが求められる。また、医薬品よりときには厳しい環境にさらされることを考慮した安定化技術が求められ、さらに食味という点でも医薬品とは違う観点からの設計が求められる点だ。

最近のサプリメントの添加剤に求められる機能を総括すると、次の3つにまとめることができる。

- ①有効成分の高含有化と錠剤の小型化ニーズを低添加で実現する成形性、流動性、崩壊性など、高機能性が求められる。
- ②低コスト化のニーズの中で造粒工程を省き製造コストを抑える直打法が人気だが、①の成分の高含有ニーズを満たしつつ錠剤の硬度や崩壊性のバランスをとり、直打を可能にするような添加剤が求められている。
- ③サプリメントでも、味や食感、飲み易さが求められており、添加剤にも口溶け、味の良さが求められる。

●賦形剤

錠剤の処方においては、古くから乳糖やでん粉系素材が賦形剤として使われていたが、打錠機の高速化や錠剤の小型化などに対応するには不十分

で、より高い成形性を達成するセルロース系素材が使われるようになっている。

旭化成ケミカルズの微結晶セルロース「セオラス」には高成形性タイプのSTシリーズと、成形性と流動性のバランスが良好なUFシリーズがあり、どちらも高い圧縮成形性がありながら錠剤の崩壊性を付与出来るのが大きな特徴。UFシリーズは同社独自の粒子設計技術で開発したもので、球に近い形状で、内部に空隙を多く有する粒子にすることにより、流動性と成形性の両立を実現。とくにUF-702は今までにない流動性（安息角34°）を有し、ポーラスな構造から従来の汎用グレードに比べて成形性に優れており、直打に最適。従来のST-02と同程度の硬度をもち、流動性を改善したUF-711も順調に伸びており、サプリメント分野での利用の中心はUFシリーズに移行してきているという。サプリメントの錠剤では年々、有効成分の添加率を高く設定する傾向が強まっているため、なるべく低添加の賦形剤で硬度を出すニーズが高まっているが、そのような場合は最も硬度が出せるST-100が適している。

光洋商会は、FMC社の微結晶セルロース「エンデュランスMCCTM」を販売している。FMC社は、微結晶セルロー

サプリメントでもOD錠の提案が活発化

サプリメントの新しい機能として、口腔内で30秒以内に溶け崩れる口腔内崩壊錠OD錠の提案が見られるようになっている。

製薬分野では高齢者の誤嚥を防ぐための機能として、30秒以内に口中で溶け崩れる崩壊性と同時に割れや欠けがないよう60N以上の硬度をもったOD錠の開発が盛んだが、サプリメントでは医薬品の処方そのままというわけにはいかず、食品で使用できる添加剤

の選択と加えて、口溶けや呈味が重要となる。

OD錠のポイントとなる崩壊剤は、医薬品ではマンニトールが使われることが多いが、マンニトールは食品では使用制限があり、サプリメントの崩壊剤としては使えないため、食品向けの処方が提案されている。

サプリメント向けOD錠で使われる添加剤としては、エリスリトール顆粒と結晶セルロース、部分α化澱粉と結晶セルロース、ハイア

ミロースコーンスターを原料とした「パフィラー 102」などが使われる。

内容成分や錠剤径によっても、添加剤の種類を選ぶ必要があるが、硬度60N前後、崩壊時間30秒以内、摩損度0.3前後の処方が理想的とされ、このような条件を満たしつつ、流動性や直打に耐え得るような添加剤の提案が添加剤サプライヤーや受託加工メーカー各社で始められている。