

スーパー崩壊剤
Primojel[®]
Primellose[®]

Primojel® 概要

- デンプングリコール酸Na (SSG) のワールドスタンダード
- 原料 : non-GMOポテトスターチ Type A
- 吸水と膨潤による迅速な崩壊を促す
- アプリケーション
 - 固形製剤 (錠剤 (湿式, 乾式) , カプセル)
 - 疎水性賦形剤と優れた崩壊性を示す。
 - 一般的な添加量 : 2-6%
- JP、EP、USPに準拠 DMF: No. 3015
- CAS No. : 9063-38-1
- 包装形態 : 50kg (外袋 : HDPEドラム、内袋 : PE)

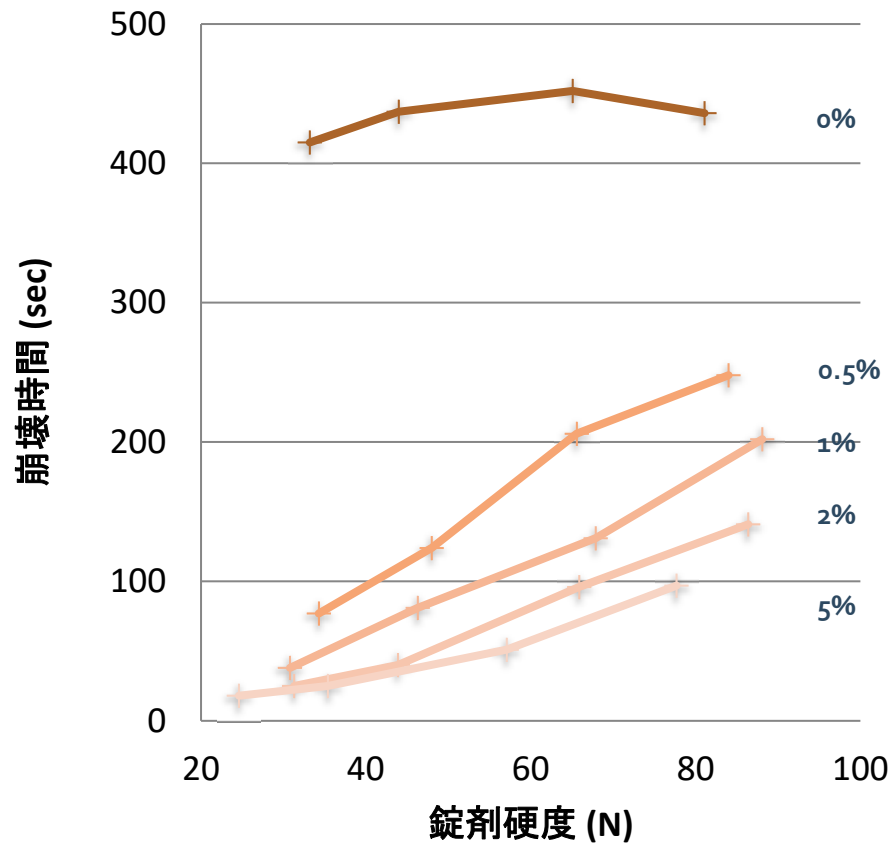


Primellose® 概要

- 原料：コットン由来のカルボキシメルチセルロース（CCS）
- セルロースの繊維構造によるキャピラリー現象及び膨潤により速やかな崩壊を促す
- クロスカルメロースNaの中で最も優れたパフォーマンスを示す（粒子サイズ・置換度の最適化）
- アプリケーション
 - 固形製剤（錠剤（湿式, 乾式）, カプセル）
 - 水溶性及び水不溶性の両賦形剤に有効。
 - 一般的な添加量：2-6%
- JP、EP、USPに準拠 DMF: No.9662
- CAS No.: 74811-65-7
- 包装形態：35kg (外袋：HDPEドラム、内袋：PE)

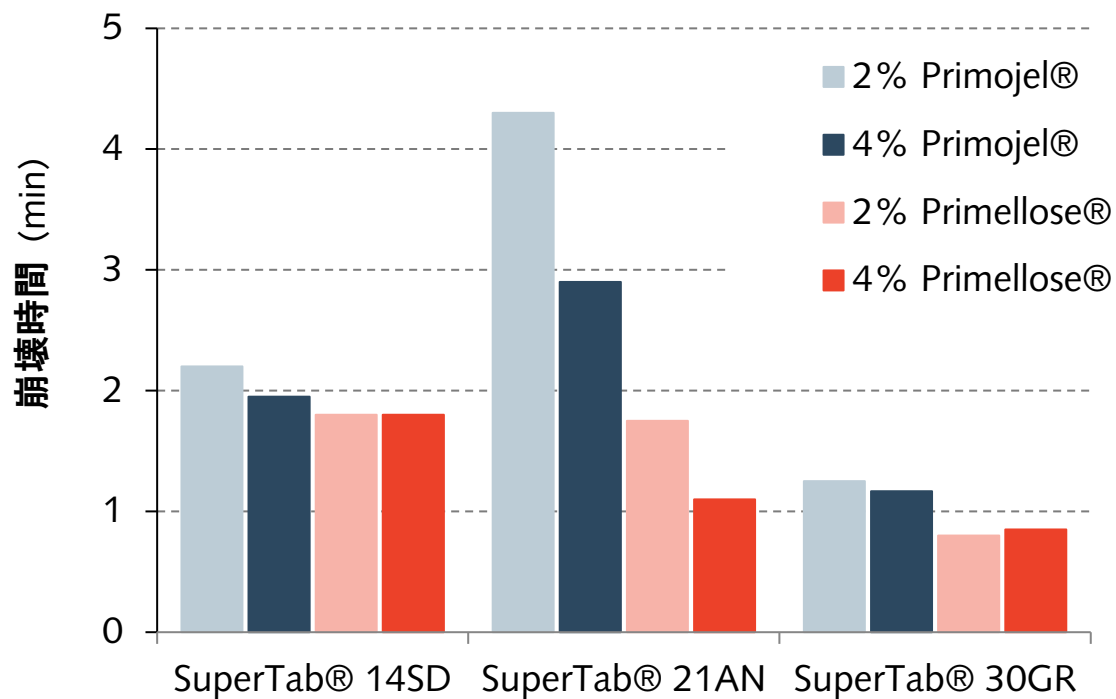


崩壊性に及ぼす崩壊剤添加量と錠剤硬度の影響



- 薬物含量：5% パラセタモール
- 錠剤重量：250 mg
- 賦形剤：SuperTab 21AN
- Primelloseの添加濃度：0%から5%
- 打錠機：Rotap
- 形状：9 mm 凹面錠

各種SuperTab[®]直打用乳糖に対する崩壊剤の崩壊効果



- 滑沢剤として、0.5% ステアリン酸Mgを含むプラセボ錠
- 250mg, 9mm
- 打錠圧：10kN

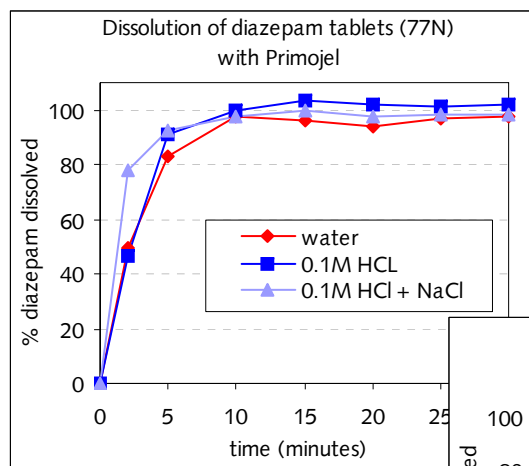
各種溶媒に対する崩壊剤の崩壊効果

成分	mg / 錠	% w/w
ジアゼパム Diazepam	2.00	2.00
SuperTab® 14SD	118.40	118.40
Pharmatose® 100M	118.40	118.40
Primojel®	10.00	-----
Primellose®	-----	10.00
ステアリン酸Mg	1.25	1.25
Total	250	250

Blending & compression to 80N (target).

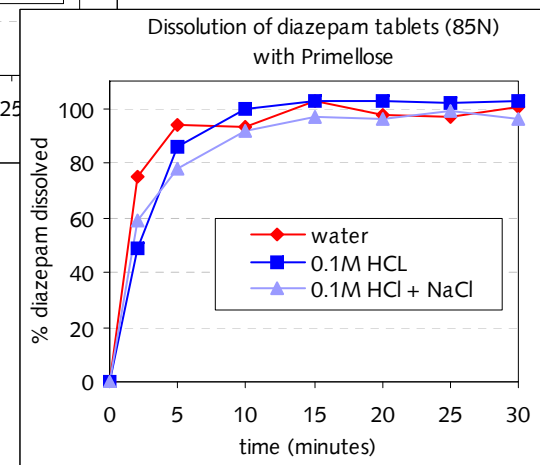
Dissolution in 3 media

- > water
- > 0.1M HCl
- > 0.1M HCl + NaCl (3.5g / L)



Primojel®錠

Primellose®錠



スーパー崩壊剤の実用例

湿式造粒法におけるスーパー崩壊剤の添加効果

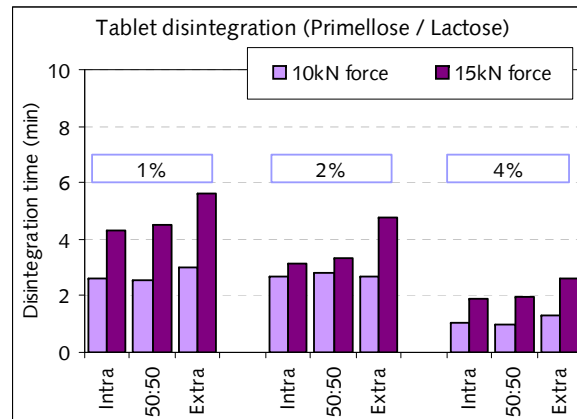
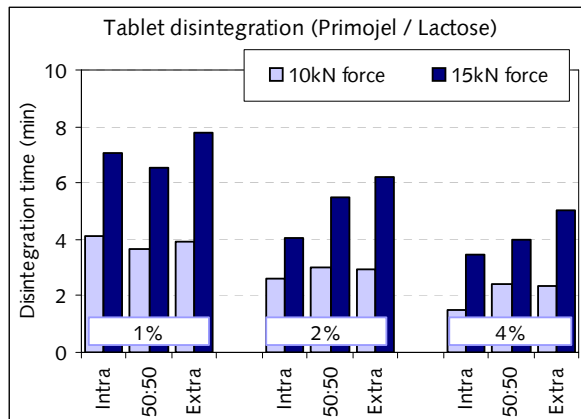
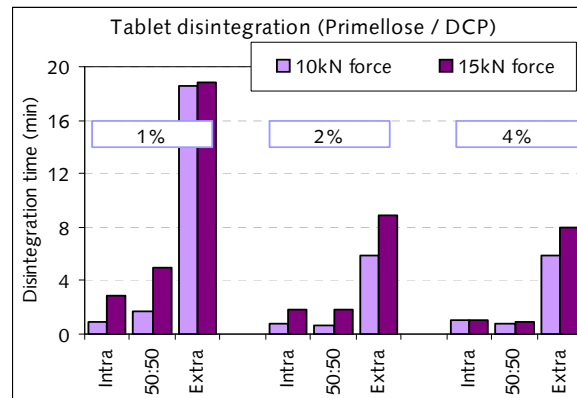
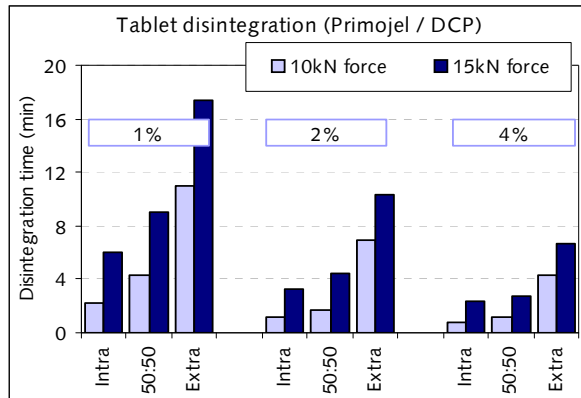
- 原薬:ジクロフェナク含量 = 25mg (250mgの錠剤中)
- 賦形剤:水溶性の乳糖及び不溶性のDCPを錠剤に用いた
- 崩壊剤:Primojel[®] (SSG)またはPrimellose[®] (CCS) を1%、2%、4%の各々の濃度で添加
- 崩壊剤の添加方法:全て顆粒内、半量ずつ分配、全て顆粒外
- 顆粒内に崩壊剤を添加する場合は、
Pro-Cept high shear granulatorを用い、
10% 又は20%の水を用いた
- 得られた錠剤の崩壊性と溶出プロファイルを確認



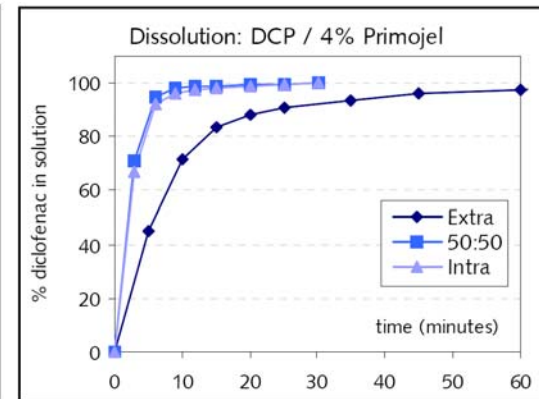
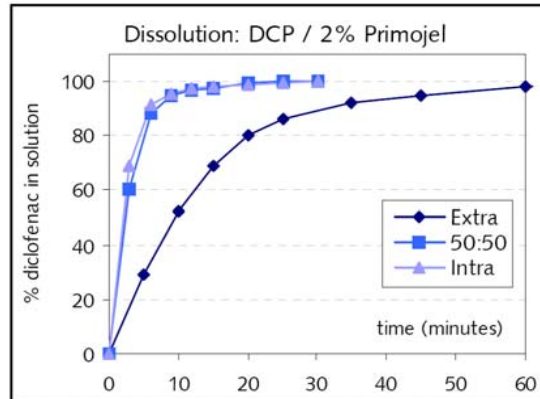
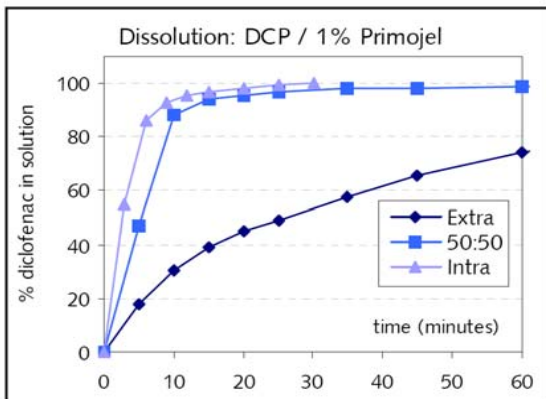
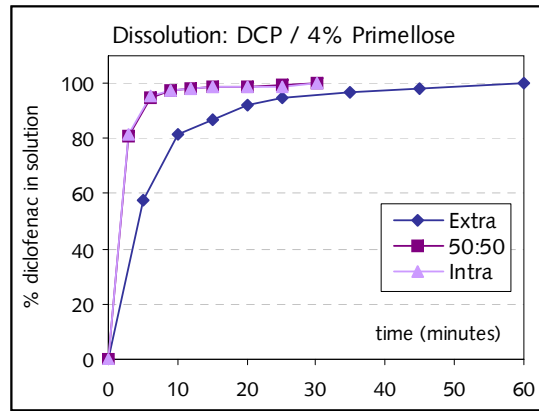
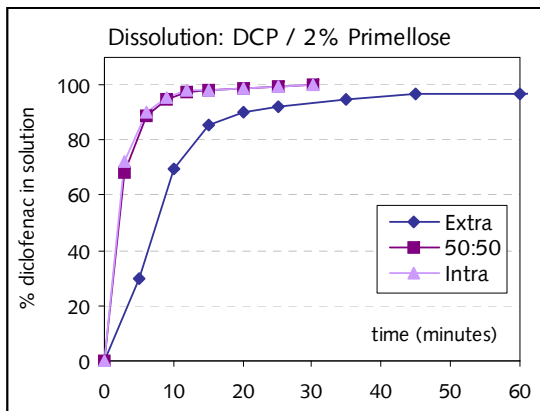
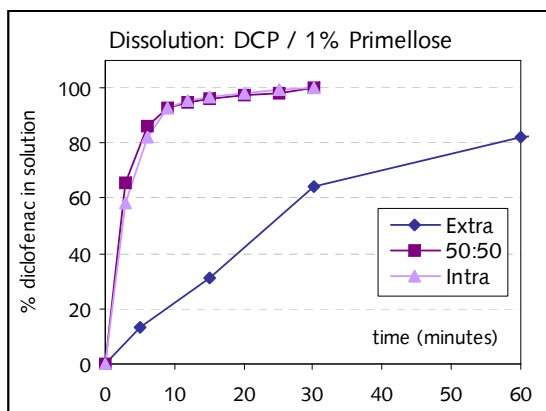
処方

成分		崩壊剤含量1%			崩壊剤含量2%			崩壊剤含量4%		
		内添	50:50	外添	内添	50:50	外添	内添	50:50	外添
内添	ジクロフェナクNa	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0
	乳糖/リン酸水素ニカルシウム	190.0	190.0	190.0	187.5	187.5	187.5	182.5	182.5	182.5
	結晶セルロース 101	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0
	ポビドン25	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
	Primojel® /Primellose®	2.5	1.25	/	5.0	2.5	/	10.0	5.0	/
外添	Primojel® /Primellose®	/	1.25	2.5	/	2.5	5.0	/	5.0	10.0
	ステアリン酸Mg	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5
Total		250.0	250.0	250.0	250.0	250.0	250.0	250.0	250.0	250.0

崩壞時間

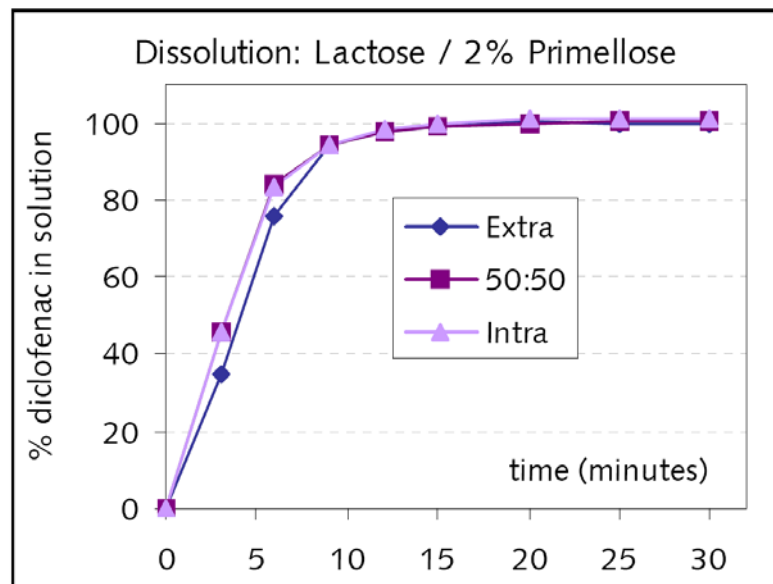
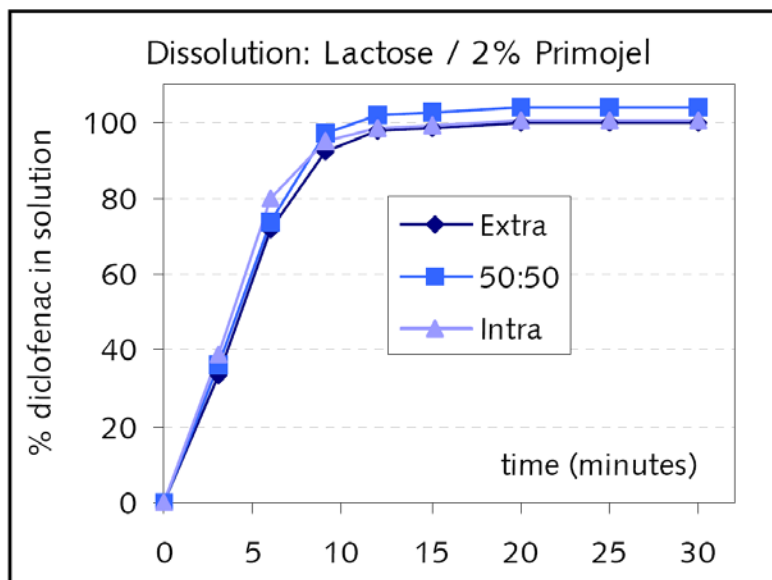


溶出性



Note USP apparatus 2 had to be operated at 100rpm to disperse the DCP.

溶出性



推奨される崩壊剤の添加方法

- Primojel®とPrimellose®は湿式造粒において全量を顆粒内に用いるか、少なくとも半量を顆粒内に用いることが推奨される。
- この方法は低い添加濃度(1%)条件下で効果的である。
- 崩壊剤の添加方法による影響は、製剤中に不溶性成分が高含有率で添加される場合、より一層顕著になる。

WE
WORK
WITH
**YOUR
FUTURE
IN MIND**