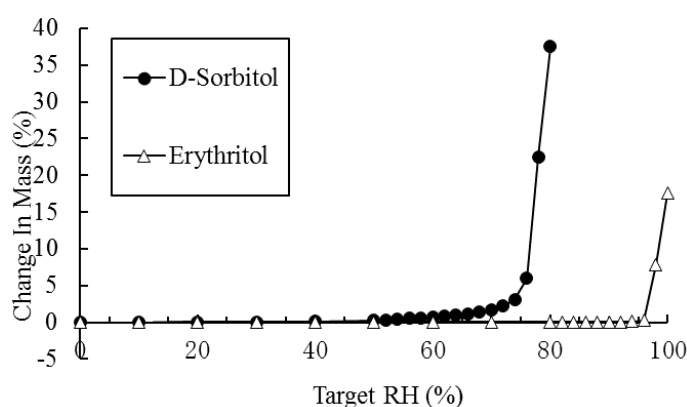


タミフルドライシロップ 3%の吸湿性改善について

1. 概要

タミフルドライシロップ 3%は、2009 年 7 月 3 日に製剤処方変更による医薬品製造販売承認事項一部変更承認を取得し新処方製剤に変更していることから、発売当初(2002 年 7 月販売開始)の旧処方製剤に比べ吸湿性が改善され、使用期限の延長も行っています。当該製品はドライシロップ剤のため、新旧処方両製剤ともに賦形剤として糖アルコールを 85%以上配合していますが、旧処方製剤に使用していた D-ソルビトールをエリスリトールに変更し吸湿性の改善を図りました。その科学的根拠として、エリスリトールは D-ソルビトールに比べ、吸湿を開始する相対湿度が高く、より高湿度に至るまで吸湿を避けることができます(下図参照)。



図・25°Cにおける D-ソルビトールとエリスリトールの吸湿等温線

2. 考察

(1) 横軸と縦軸の意味

グラフ横軸は試料の暴露された相対湿度(%)を示しています。また、縦軸はその相対湿度下で試料が吸湿して平衡となった際に、もとの試料の質量に対する質量増加分(=水分の量)を百分率で表したものです。

D-ソルビトールでは相対湿度 50%程度から、僅かながら吸湿が認められ、75%以上で急激に吸湿量が増加します。一方、エリスリトールでは相対湿度 95%程度まではほとんど吸湿を認めません。従って、25°Cにおいては D-ソルビトールは相対湿度が 75%をこえると著しく吸湿しますが、エリスリトールの場合は相対湿度が 95%になってもほとんど吸湿せず、製剤の構成成分の大部分を占める賦形剤の変更は製剤の吸湿性を改善する大きなポイントとなっています。

(2)未開封での評価

提示いたしました結果は添加剤の特性を評価したのですが、製剤については未開封であれば密栓が保たれている限り、常温で容器内の相対湿度が 75%を超えることはありません。

(3)一度開封した後の評価

開封後の製剤が暴露される環境が、例えば 25℃において、相対湿度 75%以上の場合には、(1)で回答の通り、D-ソルビトールでは吸湿が起きますが、相対湿度 95%まではエリスリトールでは起こりません。従って、開封後に製剤が暴露された相対湿度がおおむね 75%以上 95%以下であった場合に賦形剤変更後の製剤の吸湿が抑制される傾向にあると考えます。

以上