

29-0805

チョコレート風味の口腔内速崩錠（チョコレート）の開発に関する研究（No.9）
健常人を対象としたレバミピド・チョコレートの苦味マスキング効果と口腔内滞留性の検討

○福岡 悦子¹, 並木 徳之², 佐々木 忠徳³, 近藤 千聡¹, 高野 秀仁³, 桜井 史穂子¹,
山元 俊憲¹ (¹昭和大薬,²慈恵医大第三病院薬,³亀田総合病院薬)

【目的】がん化学療法時に発症する口内炎の予防と治療を目的に, 口腔内での局所剤形としてレバミピド・チョコレートを開発し, 前報(No. 8)において改良型の製造方法を確立することができた. そこで本報では, ココアパウダー添加の有無, さらに甘味料添加の有無による苦味マスキング効果や口腔内での崩壊時間などの検討, さらにレバミピドの口腔内滞留性の評価を目的として臨床薬理試験を行った.

【方法】健常人 18 名 (男女各 9 名, 平均年齢 30.0 歳) を最小化法で 3 群にランダムに割り付け, 3 剤 2 期のクロスオーバー試験を行った. 被験薬は, 主薬 (レバミピド 1 mg/錠), 崩壊剤 (ポリプラスドン[®] XL 10 %), 賦形剤 (パーテック[™] M100) に加え, A 剤: ココアパウダー無添加+アスパルテーム無添加, B 剤: ココアパウダー10%添加+アスパルテーム無添加, C 剤: ココアパウダー10%添加+アスパルテーム1%添加, の3剤とした. 評価は味覚・香り・崩壊時間・舌触りなどに関するアンケート調査で行い, VAS あるいは選択方式で回答を求め, 結果を統計解析した. また唾液中薬物濃度を測定し, 口腔内滞留性について検討した. なお, 本試験は亀田総合病院の倫理委員会の審査・承認後, 文書による同意を得て実施した.

【結果および考察】どの被験薬も, 握みやすさ・大きさ・舌触りの点で高い評価が得られた. 口腔内での平均崩壊時間は, A・B・C 剤で各々 28.8 ± 12.7 , 32.5 ± 21.3 , 36.2 ± 16.4 秒であった. B・C 剤は A 剤と比較し苦味がマスクされ, 味覚・香りの不快感が減少した. さらに C 剤は B 剤との比較でも強く苦味の減少を示した. 総合評価でも C 剤が最も高かったことから, ココアパウダーとアスパルテームの相乗的なマスキング効果が示された. また C 剤の滞留性試験では, 1 錠服用群に比べ 3 錠群でその AUC が 2.68 倍となり, 服用量の増加に伴う滞留性の上昇を示した.