

## 29-0801

シクロデキストリンを用いたエダラボンの製剤化に関する検討 1

○瀧川 朋哲<sup>1</sup>, 佐藤 利明<sup>1</sup>, 水野 敬三<sup>1</sup>, 石井 文由<sup>2</sup> (1三笠製薬研開本部,<sup>2</sup>明治薬大)

【目的】エダラボン (3-methyl-1-phenyl-2-pyrazolin-5-one; 以下 Ed と略す) は分配係数 17.2 (オクタノール/pH6 緩衝液) の脂溶性薬物であり、溶解度、吸収性の改善など製剤学的な検討が必要である。今回、Ed の製剤化における  $\beta$  シクロデキストリン ( $\beta$  CD) およびその誘導体の有用性を示差走査熱量分析 (DSC) および画像解析を用いて検討した。

【方法】DSC 測定には、Ed とともに乳鉢中で混合粉碎した  $\beta$ -CD、2-Hydroxypropyl- $\beta$ -CD (HP  $\beta$  CD) および対照としてグルコースを試験に供した。また、HP  $\beta$  CD 溶液に過剰量の Ed を添加し 37°C で 5 時間振とう後、濾過した濾液を凍結乾燥した試料に対して DSC および画像解析を行った。さらに同様に処理した溶液中の Ed の含量を測定した。

【結果及び考察】Ed と CD の混合粉碎および凍結乾燥においては Ed の吸熱ピークの消失が DSC で確認できた。また、画像解析においても HP  $\beta$  CD 溶液に溶解後凍結乾燥した Ed の結晶は認められなかった。Ed の溶解性においては Methyl- $\beta$ -CD (M  $\beta$  CD) および HP  $\beta$  CD 溶液で精製水より高い溶解性を示した。以上の結果から  $\beta$  CD およびその誘導体は Ed を非晶質化させることにより、Ed を経口投与又は非経口投与したとき Ed の吸収性を向上させる可能性を示唆した。