

## 29-0005

β-シクロデキストリン修飾カルボキシビニルポリマーの合成とその放出特性  
○渋谷 雄太<sup>1</sup>, 田口 博之<sup>1</sup>, 橋崎 要<sup>1</sup>, 齋藤 好廣<sup>1</sup>, 小川 尚武<sup>1</sup> (<sup>1</sup>日本大薬)

【緒言】シクロデキストリンは分子内に種々のゲスト分子を取り込み、包接錯体を形成することができる。この特性は、薬物の安定化、水難溶性化合物の溶解性の向上、揮発性の防止、薬物の放出制御などの目的に利用されている。本研究では、β-シクロデキストリン (CD) と水溶性高分子であるカルボキシビニルポリマー (Carbopol 941, CP) とを化学結合させた CD 修飾 CP (CDCP) の合成について検討を行った。また、得られた CDCP の製剤基材としての基礎的物性を調べた。

【実験】DMF 中、*N,N'*-dicyclohexylcarbodiimide および *N,N'*-dimethylaminopyridine を用いて CD と CP とをエステル結合させることにより、CDCP の合成を行った。得られた CDCP による可溶化能は、モデル基質としてベンゼンを用いて、静的ヘッドスペースガスクロマトグラフ改良法に基づいて測定した。CDCP 溶液からの薬物の放出性は、トリアムシノロンアセトニド (TAA) を用いて、透析チューブ(分画分子量 3500)に充填した CDCP 溶液からの TAA の放出量を HPLC で定量することにより調べた。

【結果および考察】CD と CP の仕込み割合を変えて合成を行ったところ、CDCP 中の CD 含有率は、CD/CP のモル比の増加に伴い増加したが、CD/CP のモル比が 0.5 以上になるとほぼ一定値を示すことがわかった。CDCP によるベンゼンの可溶化量は、CD と CP との物理的混合物 (PM) の場合に比べて高い値を示した。CDCP 溶液からの TAA の放出速度は、CDCP の濃度の増加に伴い減少することがわかった。さらに、PM に比べて、その放出速度は低下することが明らかになった。したがって、CDCP は、PM の場合に比べて、製剤基材として有用性が高いと考えられた。