

29P1-am331

口腔内速崩壊錠の開発(II)--疎水性薬物について--

○李 超杰¹, 阪本 光男¹, 小林 利安¹(¹秋山錠剤)

【目的】第 126 年会では、親水性モデル薬物アスコルビン酸(Vc)の口腔内速崩壊錠の開発について報告した。本報では、疎水性モデル薬物としてエテンザミド(ETZ)を用い、通常の設備で、物理的強度も満足でき、かつ服用しやすい速崩壊錠に関して、添加剤の種類、その含有量、打錠圧などの最適な処方と最適な打錠条件を検討した。さらに調製した錠剤の崩壊機構の解明を行った。

【方法】モデル薬物としてエテンザミドとアスコルビン酸を選択し、賦形剤に結晶セルロース、乳糖、マルチトール、崩壊剤にクロスポビドン、部分アルファ化デンプン、カルメロース、トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、滑沢剤にステアリン酸マグネシウム(St-Mg)を用いた。結晶乳糖を核として、ここにモデル薬物と結合剤溶液(ポリビニルピロリドン)を交互に添加し、乾燥後、コーティング粒子が得られた。そのコーティング粒子に賦形剤、崩壊剤などを配合し、ロータリー打錠機により錠剤を製した。この錠剤の崩壊時間、硬度、摩損度、ぬれ時間、膨潤度、口腔内崩壊時間などを測定した。さらに錠剤の内部構造を細孔分布と走査型電子顕微鏡により観察した。

【結果及び考察】Vc を用いたとき、崩壊剤に 3%Kollidon-CL、核に 10%結晶乳糖、滑沢剤に 0.3%St-Mg を添加し、0.4t の打錠圧で、打錠することにより、優れた物性を有する速崩壊錠が調製できることが明らかとなった。しかしながら、ETZ では、付着性が強いため、Vc と同じ製造法では、同様なコーティング粒子が得られなかった。従って、ETZ では、その物性を改善する必要があると思われた。