

浸透圧ポンプ錠の溶出特性について

○斎藤 豊和¹, 竹本 早織¹, 中嶋 武尚², 牧野 公子^{1,2} (¹東京理大薬, ²東京理大DDS研セ)

【目的】徐放性製剤の一つである浸透圧ポンプ錠は、その構造や放出機構については広く知られている。既に20年以上の歴史があり、上市された製品も相当数ある。しかし、国内においては、上市された例はなく研究報告も見掛けることがなく、詳しい内容についてはあまり知られていない。そこで、薬物層と膨潤層が分かれたタイプの浸透圧ポンプ錠を調製し、その基本的特性について検討した。

【方法】モデル薬物としてアセトアミノフェンを、浸透圧剤として塩化ナトリウム(NaCl)を、膨潤剤としてポリエチレンオキサイド(PEO)を、滑沢剤としてステアリン酸マグネシウム(Mg-st)をそれぞれ用いた。また、コーティング剤としてエチルセルロース(EC)およびポリエチレングリコール(PEG)を用いた。先ず、アセトアミノフェン、PEO、NaCl および Mg-st の混合末を、打錠機で圧縮成型して薬物層を形成した。更に、PEO、NaCl および Mg-st の混合粉末を薬物層の上に充填し、打錠して膨潤層を重ね、二層錠とした。得られた錠剤に、EC と PEG をアセトンとエタノールの混液に溶かした液をコーティングし、フィルムコート錠とした。フィルムコート錠の薬物層側被膜にドリルまたは CO₂ レーザーを用いてオリフィスを形成し、浸透圧ポンプ錠とした。溶出特性の評価は、日局パドル法により行なった。

【結果・考察】浸透圧ポンプ錠の薬物放出特性は、膨潤層の湿潤時間に相当するラグタイムに続いて、溶出率約80%までは零次の放出を示した。ラグタイムおよび放出速度は、コア錠中の浸透圧剤の量および膨潤剤の量とグレード(分子量)等の影響を受け、また、被膜中の PEG 量にも影響を受けた。未溶解の薬物でも放出できる等の、半透膜による放出制御製剤とは別の可能性が伺えた。