

26P-pm008

薬物の苦味をマスクした口腔内速崩壊錠の開発

○李 超杰¹, 阪本 光男¹, 小林 利安¹(¹秋山錠剤)

【目的】 結晶乳糖を核として、ここに水溶性高分子ポリビニルピロリドン溶液を用いて薬物を被覆したコーティング粒子を含む口腔内速崩壊錠の開発に関しては、既に、日本薬学会第 126 および 127 年会で報告した。本研究では、モデル薬物として、苦味を有する塩酸ピリドキシンを用いて、苦味をマスクした口腔内速崩壊錠の開発を目的に、核およびそのコーティングの最適処方と最適製造条件を検討した。

【方法】 モデル薬物に水不溶性高分子エチルセルロース(EC)および低融点物質シヨ糖脂肪酸エステル(SE)を混合し、この粉体を結合液で造粒した後、乾燥・整粒し、核とした。この核に粉末乳糖と SE の混合末で結合液を用いて、被覆し、コーティング粒子を得た。この粒子に賦形剤、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、口腔内崩壊時間などを測定、また、官能試験により、苦味を評価した。さらに、その錠剤からの薬物の溶出機構を解明した。

【結果及び考察】 苦味を有する薬物のマスクに関しては、核の成分組成およびその結合液組成の影響が大きかった。また、錠剤からの薬物の 30 分後の溶出率は、熱処理の影響を受けた。モデル薬物のマスクと 30 分後での速やかな錠剤からの薬物放出を満足する口腔内速崩壊錠が得られたので、その錠剤からの薬物の溶出挙動を Higuchi 式への適応、さらに、錠剤の内部構造を細孔分布測定と走査型電子顕微鏡の観察から調べた。