

27R-am01S

糖転移ステビアと界面活性剤の複合体による難水溶性薬物の溶解性改善

○藤森 美季¹, 佐藤 秀行¹, 門田 和紀¹, 戸塚 裕一¹ (¹大阪薬大)

【目的】これまで、糖転移化合物である α -Glycosyl Stevia (Stevia-G) と難水溶性薬物を溶液中で混合し、界面活性剤を添加することで薬物の溶解性が向上することを報告してきた。本研究では、薬物の溶解性改善機構解明のため、Stevia-G と界面活性剤の界面張力を測定し相互作用の評価を行った。

【方法】難溶性薬物のモデル化合物として Mefenamic acid (MFA) を選択し、Stevia-G 及び各種界面活性剤 (Lauryltrimethylammonium Chloride (LTAC) など) の物理的混合物を水に添加し 37°C で溶解度を評価した。さらに、溶解度が著しく改善された処方に関してパドル法による溶出試験を行った。また、Stevia-G と各界面活性剤の混合溶液を動的光散乱法にて測定し得られた粒子径と、界面張力から算出した臨界ミセル濃度 (CMC) 及び相互作用パラメーターから Stevia-G と界面活性剤の相互作用を評価した。

【結果と考察】MFA の溶解度は Stevia-G と界面活性剤を添加することで上昇し、LTAC を添加時に最も顕著に上昇した。この組み合わせで溶出試験を行ったところ MFA 原末 < MFA + LTAC < MFA + Stevia-G < MFA + Stevia-G + LTAC の順に溶出性の上昇が認められた。また、動的光散乱法により得られた粒子径が Stevia-G 溶液に比べ Stevia-G + LTAC 混合溶液の方が減少した。さらに、界面張力から算出した相互作用パラメーターが低下したことから Stevia-G と LTAC が複合体を形成していることが示唆された。