

28K-pm01S

ニフェジピンの光安定性に対する多孔性ケイ酸カルシウムの効果

○藤本 有未¹, 平井 伸明¹, 前田 幸千恵¹, 川原 さと実¹, 中瀬 朋夏¹, 高橋 幸一¹ (¹武庫川女大薬 薬剤学研究室)

【背景・目的】ニフェジピン(NIF)は、製造工程、貯蔵、取り扱いにおいて、光からの保護が必要な感光性薬物である。また、NIF は難水溶性薬物であり、溶出性を改善する方法として微粒化ならびに固体分散体などによる非晶質化が多く研究されている。しかし、微粒化や非晶質化は光安定性を下げる傾向にある。当研究室ではこれまでに、固体分散体制剤の開発に対する多孔性ケイ酸カルシウム(PCS)の効果を検討し、有用性を見出した。そこで本研究では、開発した固体分散体制剤中の NIF の光安定性に及ぼす PCS の影響を検討した。

【方法】PCS を用いた NIF 吸着固体分散体制剤(PCS 錠剤)の製造のために、PCS を用いた湿式造粒法にて顆粒を調製後、錠剤に製した。対照錠剤は NIF と賦形剤(結晶セルロース・無水ケイ酸)を混ぜた後に直接圧縮法により調製した。製した錠剤は、光安定性試験ガイドラインに準じて光安定性試験を行い、照射時間による NIF 残存量を HPLC にて分離定量し評価した。また、PCS の効果の詳細を検討するために、NIF-PCS 固体分散体ならびに物理混合物においても同様に評価した。

【結果・考察】光安定性試験では、対照錠剤よりも PCS 錠剤において NIF の光分解が著しく阻害された。同様に、NIF と PCS の物理混合物もまた、NIF の光分解を阻害した。光安定性試験において、PCS は遮光体としての役割を果たしていると考えられる。

【結論】PCS を用いることで、NIF の溶解性と光安定性を同時に改善した固体分散体制剤の開発が可能であることが示唆された。この方法は、難水溶性で感光性の高い薬物の製剤化に有効な方法であると考えられる。