

26PB-am002

アルギン酸を用いたゲル化錠剤の調製～溶出速度の改善～
○伊東 育己¹, 伊東 明彦², 畝崎 榮¹ (¹東京薬大薬, ²明治薬大)

【目的】現在臨床現場で用いられる経口剤の中で、錠剤はコンプライアンスや携帯性の良さから最も好まれて使用されている。しかし、小児や嚥下機能の低下した患者には、錠剤であってもコンプライアンスの低下が懸念され、また服薬補助を行う家族や医療従事者にとっても大きな負担となる恐れがある。そこで、保存時は固形で、服用時に水分を含んでゲル状となり、飲み込みやすい経口用ゲル化錠の調製を試みた。

【方法】試料:モデル薬物としてアセトアミノフェン(AA)を用いた。ゲル化剤としてアルギン酸ナトリウム(AG)、添加剤として結晶セルロース(MCC)、結合剤としてポリエチレングリコール(PEG)、キシリトール(XYL)を用いた。錠剤の調製:卓上式転動造粒機を用い造粒した試料を、油圧プレスで圧縮成形した。AA100mgの有核錠とし、成形時の圧力と時間及び外層の厚みを変化させた。錠剤の評価:1)硬度の測定:レオメーターを用い、圧縮強度試験を行った。2)厚みの測定:マイクロメーターを用いて行った。3)付着性の測定:レオメーターを用い付着試験を行った。4)吸水試験:吸水による継時的な重量変化を測定した。5)溶出試験:37℃精製水、900mLを試験液とし、溶出試験機を用いパドル法により行った。継時的に試料をサンプリングし、AA濃度を、紫外可視光度計を用いて244nmで測定した。

【結果】AG、MCC混合物の付着性、吸水性は、造粒による大きな変化はなかった。溶出速度は外層を薄くすることで速くなったが、薄くしすぎると錠剤表面がゲル状にならなかった。しかし、内層のAAを2N30秒、外層のAG、MCC混合物0.1gを4N30秒で圧縮成形(外層約0.3mm)することで、表面がゲル化し、約5分で外層が剥がれ、約60分で100%という溶出挙動となった。