

27AB-am052

水溶性高分子を用いた経口用ゲル化顆粒の調製と評価 2—粉砕混合法による調製—
○中村 絢香¹, 鈴木 康太¹, 伊東 明彦¹ (明治薬大)

【目的】薬物治療において経口剤は、患者の QOL を向上させることから汎用されている。なかでも錠剤は、その高い利便性から最も好まれる剤形である。しかし、小児、高齢者など嚥下機能が低下している患者にとって、その服用に困難を生じる場合があり、コンプライアンスの低下と治療効果の低下につながる恐れがある。そこで、嚥下性の観点から服用性を向上させる経口剤としてゲル化製剤に着目し、水溶性高分子を基剤としたゲル化顆粒の調製について検討を行った。

【方法】モデル薬物としてアセトアミノフェン (AA) を用いた。水溶性高分子としてカラギーナン (CAR)、ヒドロキシプロピルセルロース (HPMC)、カルボキシメチルセルロースナトリウム (CMC) を選択した。成形性と吸水性を考慮し、賦形剤としてケイ酸カルシウム (FL) を用いた。ゲル化顆粒は、FL と高分子の配合比率を変えた試料を 5 分間ミキサーで混合粉砕した粉末について油圧プレスを用いて圧縮成形することにより調製した。この際、AA 含有量は 200mg/g とした。顆粒の評価としては、強度、吸水性、吸水後のテクスチャー、顆粒からの AA の溶出挙動について行った。溶出試験は、37°C 精製水 900 mL を試験液としパドル法により行い、AA 濃度は、紫外可視吸光光度を用いて 244 nm で測定した。

【結果】いずれの高分子においても配合比率に関わらず、適度な強度を有した顆粒が得られた。顆粒の吸水性については、CAR を用いた場合が最も優れ、吸水量は CAR の配合量に依存して増加した。一方、他の高分子においては配合比率が高くなると吸水量が低下する傾向がみられた。顆粒からの AA の溶出は、CAR を使用した顆粒で、他の高分子を用いた顆粒に比べて遅くなる傾向が認められた。また、いずれの高分子においても配合比率に依存して緩やかな溶出挙動を示した。