

27AB-am053

アルギン酸ナトリウムを用いたゲルカプセルの徐放性製剤としての有用性

○岸村 伸¹, 江浦 将暉¹, 竹内 由佳理¹, 首藤 誠¹, 小森 浩二¹, 三田村 しのぶ¹ (¹摂南大薬)

【目的】 これまでに我々は、小児への苦味薬物の服薬コンプライアンスを向上するために、アルギン酸カルシウムゲルカプセルを開発した。これをバクタ®配合顆粒に適用し、苦味をマスクする効果及び主薬成分の T_{max} が遅延することを報告している。そこで今回、時間依存性殺菌作用を持つセフゾン®細粒小児用 10%に適用し、溶出試験及びラット経口投与後の薬物血中濃度測定を行い、徐放性製剤としての有用性について検討した。

【方法】 ゲルカプセルは、セフゾン®細粒を懸濁した 0.5%アルギン酸ナトリウム溶液を乳酸カルシウム水溶液中に滴下し作製した。溶出試験は、ゲルカプセル及びセフゾン細粒を試料とし、水、第一液 (pH1.2)、第二液 (pH6.8) を溶出液として日本薬局方に準じた条件で行った。血中濃度測定は、ゲルカプセル及び 0.5%CMC 水溶液に懸濁したセフゾン®細粒を、それぞれ同量となるように Wistar 系雄性ラットに経口投与し、経時的に採血・除タンパク処理を行った。溶出試験及び採血によって得られた試料を、遠心分離後 HPLC を用いて分析し主薬成分の溶出量及び血中濃度を定量した。

【結果・考察】 主薬成分の第一液における溶出率は、セフゾン®細粒では 10 分でほぼ全てを溶出するのに対し、ゲルカプセルでは 60 分で約 70%であった。主薬成分の T_{max} 及び $t_{1/2}$ は、両製剤間において大きな差はなかった。 C_{max} はセフゾン®細粒に対し、ゲルカプセルでは約 70%に減少した。 T_{max} が遅延しなかった原因は、 T_{max} より早い時間で最大量を溶出することであると考えられる。 今後は、生物学的同等性や徐放性を示す製剤とするため、ゲルカプセル中の薬剤の含量などを変更し、工夫を重ねていきたい。