

27PB-am172

ジェルポリマーを基剤とした新規テルビナフィン製剤の調製と評価

○新井 裕子¹, 小幡 誉子¹, 和田 直久², 島谷 隆夫², 高山 幸三¹ (¹星薬大, ²テイカ製薬)

【目的】皮膚に適用する製剤は、基剤中に薬物が溶解または分散されており、基剤が皮膚に付着し、有効成分の浸透性や塗り心地に影響を与える。基剤には有効成分に対して不活性であり、皮膚刺激性を持たないことが求められる。今回基剤として用いたジェルポリマーは、簡便に塗布することができるため、アドヒアランス向上につながると考えられる。主薬として用いたテルビナフィン(TER)は白癬菌の治療に用いられ、強い抗菌活性を示すため、爪白癬等の治療困難な疾患にも有効である。そこで本研究では、これまで化粧品等に使用実績のあるジェルポリマーを基剤として、新規 TER 製剤を調製し、市販製剤と比較してその有用性を検討した。【方法】ヘアレスマウス摘出皮膚(7 週齢、雄)を、フランツ型拡散セル(有効面積 2.01 cm²)に装着し、ドナー側に TER 製剤 0.08g を、レシーバー側にリン酸緩衝生理食塩液 (PBS, pH:7.2)を適用した。実験温度は 32℃とし、適用 8 時間後および 24 時間後の皮膚を取り出し皮膚中 TER 濃度を測定した。TER 濃度の測定は、皮膚表面を PBS に浸漬したキムワイプで拭き取った後、製剤適用部位をテープストリッピングし、テープ中の TER をメタノール溶液中で超音波照射により抽出した後 HPLC により行った。以下の表皮は細断後、メタノール溶液中でホモジネートして TER 濃度を測定した。さらに、各製剤 30mg を培養皮膚に適用し、MTT アッセイにより細胞生存率を測定し、皮膚刺激性の判定をした。【結果・考察】調製した TER 製剤の皮膚中濃度は、市販製剤と比較して、適用 8 時間後では低かったが、24 時間後では同等の濃度を示した。このことから、皮膚中濃度は時間経過とともに増加することが推察された。すべての製剤において細胞生存率は 80%以上であり、皮膚刺激性はなかった。以上の結果より、今回調製した TER 製剤は市販製剤と同等の効果を有し、ジェルポリマーは医薬品においても新たな基剤となる可能性が示唆された。