

28X-am03

ピロキシカム、メロキシカムの溶解性への弱塩基性薬物の影響

○藤田 萌々子¹, 塩野 香菜子¹, 笠井 崇央¹, 島田 洋輔¹, 後藤 了¹, 猪尾 勝幸² (¹東京理大薬,²帝國製薬)

【目的】非ステロイド性抗炎症薬 (NSAIDs) は経皮吸収性が低いため、従来から弱塩基性の局所麻酔薬を配合した経皮吸収剤の検討がなされている。NSAIDs のピロキシカム (PRX)、メロキシカム (MLX) の経皮吸収剤に局所麻酔薬であるオキシプロカイン (OXY) を配合すると、膜透過性が PRX では増加し、MLX では減少すると報告されている (特許 2011-074565)。OXY 配合による PRX と MLX の膜透過性メカニズムの報告はない。本研究では、OXY をはじめとする弱塩基性薬物存在下における PRX、MLX の溶解性への影響を検討した。

【方法】10 mM OXY 溶液は pH 7.4 リン酸緩衝液を用いて調製した。緩衝液及び OXY 溶液に PRX、MLX を過剰量加え、25°C、振盪速度 120 min⁻¹ で 1、3、6、24、48、96、168 h 振盪した。振盪したサンプルをろ過し、紫外可視分光光度計により PRX、MLX、OXY のそれぞれの濃度を測定した。

【結果・考察】PRX、MLX の溶解速度測定において、OXY 非存在下 PRX では過飽和が見られたが、MLX には見られなかった。一方 OXY 存在下ではどちらも過飽和のない飽和曲線となった。PRX、MLX の水溶性は OXY 存在下で低下した。同時に OXY の濃度は初期濃度より低下していた。膜透過性の報告とは異なり、OXY 存在下における PRX、MLX の水溶性はどちらも低下することが明らかとなった。

