

〔粉碎, 24, 88 (1979)〕

Preparation of Wax Matrices of Medicament by a Wet Spherical Agglomeration Technique

HIDEO TAKENAKA, YOSHIAKI KAWASHIMA, HARUMI MORI

湿式球形造粒法によるワックスマトリックス製剤の調製

竹中英雄, 川島嘉明, 森 晴美

製剤からの主薬の溶出速度を調節して製剤の利用率を高める方法が種々工夫されている。その中で、主薬をワックス内に分散させ主薬の溶出を徐放化させる、いわゆるワックスマトリックス製剤が注目されている。従来の本製剤の調製法は、溶融ワックス中に薬剤粉末を分散させた後冷却しこれを粉碎するか、溶融分散液を冷空气中に噴霧する方法で行われている。前者は粉碎操作が必要で粉碎物が不規則形状となるのが難点である。後者の方法では噴霧装置が必要であり、より有利な方法の開発が望まれている。本研究では湿式球形造粒法を応用してスルファメトキサゾールをモデル薬剤として球状のワックスマトリックスを製造する新しい方法を開発した。即ち、i) 溶融法と ii) 溶液法である。溶融法では蒸留水に非溶解性の薬剤粉末を攪拌機で分散させながら昇温し、約90°Cに達しせしめた後、適量のサラシミツロウを加えて造粒する。溶液法では室温で蒸留水中に非溶解性の薬剤粉末を分散させ、結合剤又はワックスのベンゼン溶液の適量を加えて攪拌しながら粒子を造粒する。マトリックスの粒度は、系の攪拌速度と液体架橋剤の使用量と逆比例の関係にあった。造粒前に薬剤を疎水化しておくともマトリックスの粒子径は有意に増大し、粒度分布が bi-modal な形となった。以上の関係を Fig に示す。液体架橋剤量を増大させると、頻度粒度分布曲線は Uni-modal 形となることも見いだされた。調製したマトリックス製剤は、溶出試験を行い、十分な徐放性を有することが確かめられた。

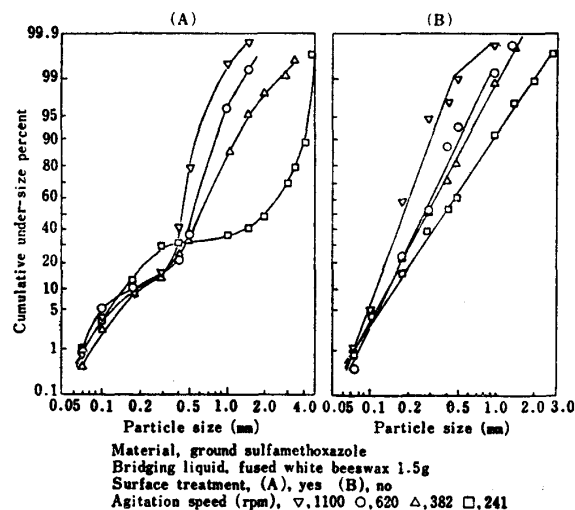


Fig. Effect of agitation speed on size distribution of matrix