

平成25年度

高齢者や小児の患者などが服用し易い経口固形製剤に関する研究

テイカ製薬株式会社

[詳細]

1 研究の実施内容及び成果に関する報告書

[1] 研究の概要

医薬品の分野における経口固形製剤の剤形としては、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤等が一般的に知られているが、いずれも服用時に水を必要とするため、高齢者・小児・幼児の患者、嚥下困難な患者、寝たきりの患者、水分摂取が制限されている患者等にとっては服用しづらいといった、患者のコンプライアンス及びアドヒアランスの面で大きな問題があるとされている。

しかしながら、近年では、これらの患者のコンプライアンス及びアドヒアランスの向上を目指し、容易にかつ安全に服用できる剤形として、口腔内の唾液で崩壊し、水なしで服用、もしくは、少量の水で服用が可能な口腔内崩壊錠が相次いで開発されてきている。

我々は、上述した内容を踏まえ、高齢者や小児などの患者にとって服用しやすい経口固形製剤として、口腔内崩壊錠という剤形を選択し、その研究を実施した。

[2] 研究の実施内容及び成果

本研究を実施する中で、口腔内の少量の唾液のみで速やかに崩壊可能な口腔内崩壊錠の製剤設計をプラットフォーム化することが可能となりました。その研究内容については、医薬品業界での情報雑誌に投稿を行っており、それらの資料[4文献]を添付しますので、それらの詳細をご確認ください。

また、上述した情報雑誌で紹介した基本データを基に、一般用医薬品の研究開発に取り組み、口腔内崩壊錠の特性を有する製剤[4品目]を上市しました。下記に、その詳細について記載します。

- (1) 下痢止め薬Ⅰ(商品名：テイカエース下痢止め)
有効成分：タンニン酸ベルベリン、ロートエキス3倍散
効能：腹痛を伴う下痢、下痢、消化不良による下痢、食あたり、吐き下し、下り腹、軟便
用法・用量：成人(15才以上)1回2錠、7~14才1回1錠、1日3回
- (2) 下痢止め薬Ⅱ(商品名：ほわっと下痢止めLP)
有効成分：ロペラミド塩酸塩
効能：食べすぎ、飲みすぎによる下痢、寝冷えによる下痢
用法・用量：成人(15才以上)1回1錠、1日2回
- (3) 乗り物酔い薬(商品名：テイカエース乗り物酔い止め)
有効成分：塩酸メクリジン、スコポラミン臭化水素酸塩水和物
効能：乗り物酔いによるめまい・吐き気・頭痛の予防及び緩和
用法・用量：成人(15才以上)1回2錠、7~14才1回1錠、1日2回
- (4) 鼻炎薬(商品名：ほわっと鼻炎KF)
有効成分：ケトチフェンフマル酸塩
効能：花粉、ハウスダスト(室内塵)などによる次のような鼻のアレルギー症状の緩和：くしゃみ、鼻みず(鼻汁過多)、鼻づまり
用法・用量：成人(15才以上)1回1錠、1日2回 ※朝食後及び就寝前に服用する。

[3] 現状における課題の問題点

口腔内崩壊錠は、口腔内での溶解具合が非常に重要な要因ではありますが、その他に、口腔内で拡散する薬物の味、特に、苦みは、患者の服用性を悪くする要因となっています。そのため、製剤に含有する薬物の苦みをマスクングする必要があり、一般に、①官能性マスクング、②化学的マスクング、③物理的マスクングの3つの手法が採られています。各々の手法には、メリットやデメリットがあります。

[2]で述べた、上市された製剤は、余り苦みを有しない薬物を含有しているため、苦みマスクングを①の官能的マスクングを採用することで、良好に進めることが可能ではありましたが、今後、苦みの強度が高い薬物を含有する製剤にどのように対応するかを考慮していく必要があると考えています。

[4] 今後の目標と展開

上述した内容を踏まえ、崩壊性と共に、官能性にも優れた製剤設計に努め、更なるプラットフォーム化を進めていく予定としています。また、上市した4品目以外でも、ニーズが高い製剤については研究開発を行い、それらの市場化を目指して進めていくつもりです。