

การพัฒนายาเม็ดแก้ปวดพริชชนิดละลายตัว
ด้วยสารเกิดฟองฟู

นาย วรพงษ์ มณีพรหม
นาย อัศเรศ ยิ้มเอี่ยม

โครงการพิเศษนี้เป็นส่วนหนึ่งของการศึกษาตามหลักสูตร
ปริญญาเภสัชศาสตรบัณฑิต
คณะเภสัชศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล
พ.ศ. 2547

DEVELOPMENT OF FLOATING CAPTOPRIL TABLETS USING EFFERVESCENT MIXTURE

MR. WORAPONG MANEEPROM

MR. AKARES YIM-IAM

A SPECIAL PROJECT SUBMITTED IN PARTIAL FULFILMENT
OF THE REQUIREMENT FOR
THE BACHELOR DEGREE OF SCIENCE IN PHARMACY
FACULTY OF PHARMACY
MAHIDOL UNIVERSITY

2004

โครงการพิเศษ

เรื่อง การพัฒนายาเม็ดแคปซูลโพรลีนดิลอยตัวด้วยสารเกิดฟองฟู

.....
นายวรพงษ์ มณีพรหม

.....
นายอัศวศ ยิ้มเยี่ยม

.....
(รศ.ดร.สาธิต พุทธิพิพัฒน์ขจร)
อาจารย์ที่ปรึกษา

บทคัดย่อ

การพัฒนายาเม็ดแคปโตพริลชนิดละลายตัวด้วยสารที่เกิดฟองฟู

วรพงษ์ มณีพรหม, อัครเศ ยิ้มเยี่ยม

อาจารย์ที่ปรึกษา: สานิต พุทธิพิพัฒน์ขจร

ภาควิชาเภสัชอุตสาหกรรม คณะเภสัชศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล

คำสำคัญ: แคปโตพริล, ยาเม็ด, สารเกิดฟองฟู

แคปโตพริล เป็นยาลดความดันโลหิตที่มีความคงตัวในกระเพาะอาหารซึ่งมีสภาวะกรดแต่จะเสื่อมสลายในสภาวะด่างของลำไส้เล็ก ดังนั้นจึงมีแนวคิดพัฒนาดำรับยาเม็ดแคปโตพริลชนิดละลายตัวในกระเพาะอาหารด้วยสารที่ทำให้เกิดฟองฟู โดยออกแบบระบบนำส่งยาประกอบด้วยยาเม็ดแกนและชั้นเคลือบ 3 ชั้น ได้แก่ ชั้นป้องกัน ชั้นสารฟองฟู และชั้นพอลิเมอร์ ยาเม็ดแกนประกอบด้วยยาแคปโตพริล 50 มก.และสารเพิ่มปริมาณ Supertab® และ Avicel®PH101 ในอัตราส่วน 55:45 โดยน้ำหนัก ชั้นป้องกันเป็นชั้นฟิล์ม Methocel®E15LV ที่พลาสติไซส์ด้วย PEG6000 ช่วยหลีกเลี่ยงการสัมผัสโดยตรงของยากับ NaHCO_3 ในชั้นสารฟองฟู ชั้นสารฟองฟูประกอบด้วย NaHCO_3 และ Methocel®E15LV ในอัตราส่วนต่าง ๆ โดยน้ำหนักคือ 0:100, 25:75, 50:50 และ 75:25 ทำหน้าที่ปลดปล่อย CO_2 เมื่อสารละลายกรดซึมผ่านเข้าเม็ดยา ชั้นพอลิเมอร์เป็นชั้นฟิล์ม Eudragit®RL30D ที่พลาสติไซส์ด้วย dibutyl sebacate ทำหน้าที่เก็บกัก CO_2 ที่เกิดขึ้นและควบคุมการปลดปล่อยยา ผลการทดลองพบว่า การเพิ่มปริมาณ NaHCO_3 ทำให้ความแข็งแรงของยาเม็ดลดลง แต่การเพิ่มปริมาณ Eudragit®RL30D ทำให้ความแข็งแรงของยาเม็ดเพิ่มขึ้น การศึกษาการละลายตัวของยาเม็ดพบว่า การเพิ่มปริมาณ NaHCO_3 ไม่มีผลต่อเวลาที่เริ่มละลายตัว แต่มีผลต่อระยะเวลาในการละลายตัว นอกจากนั้นผลการทดลองพบว่า การปลดปล่อยยาเพิ่มขึ้น เมื่อปริมาณ NaHCO_3 เพิ่มขึ้น แต่การปลดปล่อยยาลดลงเมื่อเพิ่มปริมาณ Eudragit®RL30D

Abstract

Development of floating captopril tablets using effervescent mixture

Worapong Maneeprom, Akares Yim-iam

Project adviser: Satit puttipipatkachorn

Department of Manufacturing Pharmacy, Faculty of Pharmacy, Mahidol University

Keyword: captopril, tablets, effervescent agent

Captopril, an antihypertensive drug, is stable in acidic condition of stomach whereas it undergoes decomposition in basic condition of intestine. Therefore, an approach to formulate Captopril tablets intended to float in stomach was developed by using effervescent agent. Drug delivery system was designed as drug-containing cores coated with inner protective layer, middle effervescent layer and outer polymeric layer. The core containing 50 mg of captopril and 55:45 w/w of Supertab[®] and Avicel[®] PH101 as fillers was prepared by direct compression. The inner protective layer of Methocel[®] E15LV film plasticized with PEG6000 was applied to avoid the direct contact of drug with NaHCO₃ in effervescent layer. The middle effervescent layer containing NaHCO₃ and Methocel[®] E15LV at different weight ratio (0:100, 25:75, 50:50, and 75:25) could generate CO₂ when acidic medium was penetrated. The outer polymeric layer of Eudragit[®] RL30D film plasticized with dibutyl sebacate was used to entrap generated CO₂ and control drug release. The results indicated that increasing amount of NaHCO₃ caused a decrease in tablet hardness whereas increasing amount of Eudragit[®] RL30D caused an increase in tablet hardness. Floating study revealed that increasing amount of NaHCO₃ did not affect time to float but did affect on floating time. Furthermore, the results indicated that drug release increased with increasing amount of NaHCO₃, but decreased with increasing amount of Eudragit[®] RL30D