

การพัฒนาตำรับยาเม็ดควบคุมการปลดปล่อยด้วยยา  
ลอร่าทาดีน/ฟินิลเอฟเฟริน

นายอภิชา เจริญภิญโญชัย  
นายสีบศิริ บำรุงชาติอุดม

โครงการพิเศษนี้เป็นส่วนหนึ่งของการศึกษาตามหลักสูตร  
ปริญญาเภสัชศาสตรบัณฑิต  
คณะเภสัชศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล  
พ.ศ. 2554

DEVELOPMENT OF LORATADINE/  
PHENYLEPHRINE CONTROLLED RELEASE  
TABLETS

MISTER APHICHA CHAROENPHINYOCHAI  
MISTER SUEBSIRI BUMRUNGCHADUDOM

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

2011

โครงการพิเศษ

เรื่อง การพัฒนาตำรับยาเม็ดควบคุมการปลดปล่อยตัวยาโลหะหนัก/ฟีนิล  
เอพฟริน

ลายเซ็น

.....  
(นายอภิชา เจริญภิญโญชัย)

ลายเซ็น

.....  
(นายสืบศิริ บำรุงชาติอุดม)

ลายเซ็น

.....  
(ศ.ดร.ณรงค์ สารีสุต)

อาจารย์ที่ปรึกษา

## บทคัดย่อ

### การพัฒนาตำรับยาเม็ดควบคุมการปลดปล่อยตัวยา ลอราทาดีน/ฟีนิลเอฟพรีน

อภิชา เจริญภิญโญชัย, สืบศิริ บำรุงชาติอุดม

อาจารย์ที่ปรึกษา: ณรงค์ สาริสุต

ภาควิชาเภสัชอุตสาหกรรม คณะเภสัชศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล

**คำสำคัญ:** ลอราทาดีน, ฟีนิลเอฟพรีน, ยาเม็ดชนิดควบคุมการปลดปล่อย, การเคลือบฟิล์ม, มาทริกซ์

โครงการนี้มีวัตถุประสงค์เพื่อพัฒนาสูตรตำรับยาเม็ดควบคุมการปลดปล่อยตัวยา ลอราทาดีน (ยาด้านฮิสตามีน) /ฟีนิลเอฟพรีน (ยาลดน้ำมูก) เนื่องจากเภสัชจลนศาสตร์ของยาทั้งสองชนิดแตกต่างกันคือ ลอราทาดีนมีค่าครึ่งชีวิตยาว ส่วนฟีนิลเอฟพรีนมีค่าครึ่งชีวิตสั้น จึงต้องเตรียมยาเม็ดที่มีรูปแบบการปลดปล่อยต่างกัน ประกอบด้วยยาเม็ดแกนที่ควบคุมการปลดปล่อยฟีนิลเอฟพรีนได้นาน เคลือบด้วยฟิล์มที่มีตัวยาลอราทาดีนและฟีนิลเอฟพรีนที่ปลดปล่อยทันที ยาเม็ดแกนฟีนิลเอฟพรีนเตรียมโดยใช้หลักการแพร่ผ่านมาทริกซ์ สารโพลีเมอร์มาทริกซ์ที่ใช้คือ Eudragit RSPO อย่างเดียวและส่วนผสมของ Eudragit RSPO กับ Eudragit L100 ในอัตราส่วน 2 : 1 ทดลองปรับปริมาณสารมาทริกซ์ที่ 20 %, 30 %, และ 40 % ของตำรับนอกจากนี้ เตรียมยาเม็ดแกนโดยใช้หลักการแพร่ผ่านเมมเบรน โดยเตรียมยาเม็ดแกนที่มีตัวยาฟีนิลเอฟพรีน เคลือบด้วยฟิล์มที่ประกอบด้วย Eudragit RS100 ให้มีน้ำหนักของฟิล์มในอยู่ช่วง 2-4 % จากนั้นนำยาเม็ดแกนทั้งสองแบบที่มีการปลดปล่อยตามต้องการ ไปเคลือบด้วยชั้นฟิล์มที่มีตัวยาลอราทาดีนและฟีนิลเอฟพรีนที่ปลดปล่อยทันที ในการศึกษาอัตราการปลดปล่อยตัวยาทั้งสองชนิดด้วยวิธี USP 34 basket method ความเร็ว 50 รอบต่อนาที ในสารละลาย 0.1 N HCl ในเวลา 2 ชม.แรกและต่อมาใน phosphate buffer pH 6.8 เป็นเวลา 10 ชม. พบว่ายาเม็ดแกนที่ใช้หลักการแพร่ผ่านมาทริกซ์มีอัตราการปลดปล่อยฟีนิลเอฟพรีนไม่เป็นไปตามที่ต้องการ ส่วนยาเม็ดแกนที่ใช้หลักการแพร่ผ่านเมมเบรนมีอัตราการปลดปล่อยยาใกล้เคียงตามที่ต้องการมากที่สุดคือ 3.14 มก./ชม. ที่น้ำหนักฟิล์มเท่ากับ 2.45 % ฟิล์มเคลือบที่ปลดปล่อยยาทันที มีปริมาณลอราทาดีนปลดปล่อยออกมาไม่น้อยกว่า 80% ที่เวลา 60 นาที ตามข้อกำหนด USP 34

## Abstract

### Development of Loratadine/Phenylephrine Controlled Release Tablets

Aphicha Charoenphinyochai, Suebsiri Bumrungchadudom

Project advisor : Narong Sarisuta

Department of Manufacturing Pharmacy, Faculty of Pharmacy, Mahidol University

Keyword: Loratadine, Phenylephrine, Controlled release tablets, Film coating tablet

The purpose of this study was to develop formulation of loratadine(antihistamine)/phenylephrine (decongestant) controlled-release tablets. Due to their differences in pharmacokinetic profiles, i.e. loratadine has long half-life while phenylephrine has short half-life, controlled-release tablets with different drug release rates were designed. The tablets would consist of prolonged-release phenylephrine core and immediate-release loratadine/phenylephrine coating. The prolonged-release phenylephrine cores using matrix diffusion-controlled system were composed of Eudragit RSPO and Eudragit RSPO:Eudragit L100 mixture at 2:1 ratio as polymer matrices at 20%, 30%, and 40%. Another prolonged-release phenylephrine cores using membrane diffusion-controlled system were coated with Eudragit RS100 film at 2-4%. Subsequently, these two types of core tablets were coated with immediate-release films containing loratadine and phenylephrine. The release studies of these two drugs were performed using the USP34 basket method at 50 rpm in 0.1N HCl for the first 2 hr and pH 6.8 phosphate buffer for the next 10 hr. The results showed that the release rate of phenylephrine from tablets prepared by matrix diffusion-controlled system was not satisfied. On the other hand, those prepared by membrane diffusion-controlled system with film-coating at 2.45% had the rate closed to the desired rate of 3.14 mg/hr. The drug released from immediate-release loratadine coating was not less than 80% within 60 minutes which was complied with USP34.