

การศึกษานี้เป็นการพัฒนายาเม็ดลอยตัวโดยอาศัยสารฟองฟู โดยใช้ theophylline เป็นยาต้นแบบ ยาเม็ดลอยตัวประกอบด้วยยาเม็ดแกนซึ่งมีตัวยาลำคัญอยู่ภายใน เคลือบด้วยชั้นเคลือบสารฟองฟู (sodium bicarbonate) และชั้นเคลือบพอลิเมอร์กักเก็บแก๊สตามลำดับ มีการประเมินคุณสมบัติเชิงกลของแผ่นฟิล์มพอลิเมอร์เพื่อหาพอลิเมอร์ที่เหมาะสมสำหรับยาเม็ดลอยตัว ศึกษาผลของตัวแปรต่างๆ ในตำรับ เช่น วิธีการเติมสารฟองฟูในระบบนำส่งยา (เติมในยาเม็ดแกนหรือเคลือบภายนอกยาเม็ดแกน) ชนิดและอัตราส่วนของพอลิเมอร์ในชั้นเคลือบกักเก็บแก๊ส (Eudragit® RL30D:Eudragit® RS30D; 100:0, 50:50, 0:100) และระดับของชั้นเคลือบกักเก็บแก๊ส (2.5%, 5%, 10% w/w) ต่อความสามารถในการลอยตัวและการปลดปล่อยตัวยา จากการศึกษพบว่าพอลิเมอร์ที่น่าจะเหมาะสมสำหรับเตรียมชั้นเคลือบกักเก็บแก๊สของยาเม็ดลอยตัวคือ Eudragit® RL 30D หรือ Eudragit® RS 30D เพราะให้แผ่นฟิล์มที่มีความยืดหยุ่นดี ยาเม็ดลอยตัวที่มีการเติมสารฟองฟูภายในยาเม็ดแกนมีค่า time to float และการปลดปล่อยตัวยาเร็วกว่ายาเม็ดลอยตัวที่เติมสารฟองฟูโดยการเคลือบภายนอกยาเม็ดแกน ยาเม็ดลอยตัวที่ประกอบด้วยชั้นเคลือบกักเก็บแก๊สที่เป็น Eudragit® RL30D สามารถลอยตัวได้อย่างรวดเร็ว แต่มีการปลดปล่อยตัวยาเร็วกว่ายาเม็ดลอยตัวที่ประกอบด้วยชั้นเคลือบกักเก็บแก๊สที่เป็น Eudragit® RS30D ซึ่งไม่สามารถลอยตัวได้ การลดอัตราส่วนของ Eudragit® RL30D ในชั้นเคลือบกักเก็บแก๊สและการเพิ่มระดับของชั้นเคลือบกักเก็บแก๊ส จะเพิ่ม time to float และทำให้การปลดปล่อยตัวยาช้าลง พบว่าทุกตำรับที่ดีมี floating time นานกว่า 12 ชั่วโมง จากการศึกษาแสดงให้เห็นว่าความสามารถในการลอยตัวและการปลดปล่อยตัวยาของยาเม็ดลอยตัวสามารถปรับเปลี่ยนได้โดยการเปลี่ยนแปลงตัวแปรในตำรับ และยาเม็ดลอยตัวตำรับที่ดีที่พัฒนาขึ้นนี้มีความสามารถในการลอยตัวดี (time to float น้อยกว่า 15 นาที, floating time มากกว่า 12 ชั่วโมง) มีการปลดปล่อยตัวยาช้าๆ จึงมีแนวโน้มที่จะนำไปใช้เป็นระบบนำส่งยาคงค้างในกระเพาะอาหารได้จริงต่อไป

The floating tablet based on effervescent agent was developed. Theophylline was used as a model drug. The system consists of drug-containing core tablet which coated with effervescent layer (sodium bicarbonate) and gas-entrapped polymeric membrane, respectively. Mechanical properties of polymeric films were evaluated in order to screen a suitable film for the floating tablets. The effects of formulation variables such as effervescent agent incorporating method (intra-core tablet or external coating), type of polymers and polymer ratio in gas-entrapped membrane (Eudragit<sup>®</sup> RL30D:Eudragit<sup>®</sup> RS30D; 100:0, 50:50, 0:100), gas-entrapped polymeric membrane level (2.5%, 5%, 10% w/w) on floating abilities and drug release were investigated. The results demonstrated that Eudragit<sup>®</sup> RS30D or Eudragit<sup>®</sup> RL30D seemed to be suitable to use as a gas-entrapped membrane for the floating tablets because they provided high flexible films. The floating tablet with effervescent containing core tablet had shorter time to float and faster drug release than the floating tablet with external effervescent coating. The floating tablets using Eudragit<sup>®</sup> RL30D as a gas-entrapped membrane could float quickly but showed faster drug release than the floating tablets using Eudragit<sup>®</sup> RS30D as a gas-entrapped membrane which could not float. Decreasing ratio of Eudragit<sup>®</sup> RL30D in gas-entrapped membrane and increasing coating level of gas-entrapped membrane of the floating tablets increased time to float and retarded drug release. Good floating tablet formulations maintained buoyancy longer than 12 hours. According to these results, floating abilities and drug release of the floating tablet could be modified by formulation variables and good floating ability (time to float less than 15 minutes, floating time more than 12 hours) with sustained release floating tablets was achieved in the optimized formulation in this study. The floating tablet developed in this study is promising as a carrier for gastroretentive DDS.