

การดื้อยาของปรสิตที่ก่อโรคมalariaเรื้อรังต่อยาต้านมาลาเรียที่ใช้กันอยู่ นำไปสู่การค้นพบยาต้านมาลาเรียจากสมุนไพรซึ่งหาที่มีประสิทธิภาพสูงกว่า ในช่วงทศวรรษนี้ การรักษาโรคมalariaเรื้อรังด้วย artemisinin และอนุพันธ์ ได้รับความสนใจเป็นอย่างมาก อย่างไรก็ตามการพัฒนาเภสัชภัณฑ์ของยากลุ่มนี้ยังขาดข้อมูลเชิงวิทยาศาสตร์ การวิจัยนี้จึงสนใจพัฒนา dihydroartemisinin ในรูปของยาแคปซูลและยาเม็ดที่ละลายเร็ว สารลดแรงตึงผิวได้แก่ sodium lauryl sulfate (SLS) และ sodium dioctyl sulfosuccinate (SDSS) ถูกนำมาใช้เพื่อเพิ่มการละลายของยาแคปซูล dihydroartemisinin ผลการทดลอง แสดงให้เห็นว่าตำรับยาแคปซูล dihydroartemisinin ที่ประกอบด้วย สารลดแรงตึงผิวในความเข้มข้น 0.5-1.5% สามารถเพิ่มการละลายของยาจากแคปซูล และแสดงคุณสมบัติด้านการละลายไม่ด้อยกว่ายาผง Cotecxin[®] และในการพัฒนาตำรับยาเม็ด dihydroartemisinin นั้น สารลดแรงตึงผิว ได้แก่ SLS และสารช่วยแตกตัว ถูกนำมาใช้เป็นส่วนประกอบของตำรับเพื่อเพิ่มการละลายของยา ผลการศึกษาพบว่า ตำรับยาเม็ดที่ประกอบด้วย 1% SLS และ 5% sodium starch glycolate แสดงคุณสมบัติการปลดปล่อยยาได้เร็วที่สุด และยาเม็ดทุกตำรับที่มีสารลดแรงตึงผิวและสารช่วยแตกตัวเป็นส่วนประกอบสามารถปลดปล่อยตัวยาได้ดีกว่ายาเม็ด Cotecxin[®] การวิจัยนี้สรุปได้ว่า การใช้สารลดแรงตึงผิวและสารช่วยแตกตัวในตำรับยาแคปซูลและยาเม็ด สามารถเพิ่มการละลายของยา dihydroartemisinin จากยาแคปซูลและยาเม็ด ยาแคปซูลและยาเม็ดชนิดละลายเร็วที่ได้จากการศึกษานี้ สามารถนำไปประเมินประสิทธิภาพทางคลินิกและการผลิตขึ้นอุตสาหกรรมต่อไป

ABSTRACT

TE 132904

The development of resistance of malaria parasite against the drugs used for treatment of malaria led to the discovery of more effective antimalarial drugs derived from Quinghao. Artemisinin and derivatives are of much interest in malaria treatment in this decade. However, the formulation of these drugs have still lack of scientific data support. Therefore, the attempt was made to study the formulation of dihydroartemisinin in the form of fast released capsule and tablet. Surfactants such as sodium lauryl sulfate (SLS) and sodium dioctyl sulfosuccinate were used for improvement of dissolution characteristics of dihydroartemisinin. The results obtained revealed that the dihydroartemisinin capsule containing surfactant at the concentrations of 0.5-1.5% could enhance the drug release from capsule and showed comparable dissolution with Cotecxin[®] powder. For the development of dihydroartemisinin tablet, the surfactant (SLS) together with disintegrant was used to improve the dissolution property. The formulation using 1% SLS and 5% sodium starch glycolate showed the best fast-release characteristics. In addition, the dihydroartemisinin tablets containing surfactant and disintegrant were superior in dissolution to Cotecxin[®] tablet. In conclusion, the use of surfactant as well as disintegrant in the capsule and tablet formulations could enhance the dissolution characteristics of dihydroartemisinin from the dosage form. In this study, the fast released capsule and tablet of dihydroartemisinin could be obtained for further clinical evaluation as well as industrial scale-up.