

メキタジン小児用シロップ0.03%「タイヨー」の配合変化試験

試験目的

メキタジン小児用シロップ 0.03%「タイヨー」は、1mL 中に有効成分としてメキタジンを 0.3mg 含有するアレルギー性疾患治療剤である。今回、本製剤の配合変化試験を実施したので報告する。

試験材料

[試験製剤]

メキタジン小児用シロップ 0.03%「タイヨー」 Lot. 621003
テバ製薬株式会社(旧 大洋薬品工業株式会社)

[配合製剤]

ムコダインシロップ 5% Lot. H071 杏林製薬株式会社
ムコソルバンシロップ Lot. A74002 帝人ファーマ株式会社
メプチンシロップ 5 μ g/mL Lot. 7D94C 大塚製薬株式会社

試験方法

メキタジン小児用シロップ0.03%「タイヨー」を表1の組合せで配合し、気密プラスチック製容器に入れ、室温(遮光下)にて保管した。これらの検体につき、配合直後、1日後、3日後、7日後及び14日後に外観観察、pH測定及びメキタジンの定量(液体クロマトグラフィー)を実施した。

表 1 配合組合せ

検体	配合製剤
配合①	メキタジン小児用シロップ 0.03%「タイヨー」 6mL ムコダインシロップ 5% 6mL ムコソルバンシロップ 3mL
配合②	メキタジン小児用シロップ 0.03%「タイヨー」 4mL メプチンシロップ 5 μ g/mL 4mL ムコソルバンシロップ 4mL

試験結果

メキタジン小児用シロップ 0.03%「タイヨー」の配合変化試験結果を表 2 に示す。その結果、配合①の検体は、配合直後と比較して 14 日後まで、外観、pH 及びメキタジンの含量にほとんど変化を認めなかった。一方、配合②の検体は、配合直後と比較して 14 日後まで外観と pH に変化を認めなかったが、メキタジンの含量低下を認めた。

表2 配合変化試験結果

検体	保存条件	試験項目 ^{注)}	配合直後	1日後	3日後	7日後	14日後
配合①	室温 (遮光)	外観	淡褐色澄明	淡褐色澄明	淡褐色澄明	淡褐色澄明	淡褐色澄明
		pH±S. D.	5.65±0.01	5.63±0.01	5.66±0.01	5.64±0.01	5.65±0.01
		定量(%)	100	98.5	100.0	99.9	97.6
配合②	室温 (遮光)	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH±S. D.	4.61±0.01	4.59±0.01	4.59±0.01	4.56±0.01	4.59±0.01
		定量(%)	100	94.6	89.0	77.3	64.6

注) 定量は配合直後を100とした残存率で示した。

結論

メキタジン小児用シロップ0.03%「タイヨー」の配合変化試験を実施した。その結果、配合①(メキタジン小児用シロップ0.03%「タイヨー」/ムコダインシロップ5%/ムコソルバンシロップ(6:6:3))は、配合直後と比較して14日後まで、外観、pH及びメキタジンの含量にほとんど変化を認めず、安定であった。一方、配合②(メキタジン小児用シロップ0.03%「タイヨー」/メプチンシロップ5 μ g/mL/ムコソルバンシロップ(4:4:4))は、配合直後と比較して14日後まで外観とpHに変化を認めなかったが、メキタジンの含量低下を認めた。

これにより、メキタジン小児用シロップ0.03%「タイヨー」/メプチンシロップ5 μ g/mL/ムコソルバンシロップ(4:4:4)の配合は避けるべきと考えられた。なお、本品の先発製剤であるゼスランシロップとムコソルバンシロップの配合(20:18)で、今回の配合②と同様にメキタジンの含量低下が報告されている¹⁾。配合①ではメキタジン小児用シロップ0.03%「タイヨー」とムコソルバンシロップの配合割合が異なる(6:3)ことにより、メキタジンの含量低下を認めず安定であったが、メキタジン小児用シロップ0.03%「タイヨー」とムコソルバンシロップの配合は避けることが望ましいと考える。

参考文献

- 1) 仲川義人 編, 細谷 順 著, シロップ剤の配合変化, 医薬ジャーナル社