

• 計畫中文名稱	迅速作用的微乳膠與奈米乳膠 Sildenafil 鼻噴劑之發展研究		
• 計畫英文名稱	Development of Sildenafil Microemulsion and Nanoemulsion for Rapid-Onset Nasal Spray		
• 系統編號	PC9607-0577	• 研究性質	基礎研究
• 計畫編號	NSC96-2320-B038-010-MY3	• 研究方式	學術補助
• 主管機關	行政院國家科學委員會	• 研究期間	9608 ~ 9707
• 執行機構	臺北醫學大學藥學系(所)		
• 年度	96 年	• 研究經費	1100 千元
• 研究領域	藥學		
• 研究人員	何秀娥		
• 中文關鍵字	--		
• 英文關鍵字	--		
• 中文摘要	<p>Sildenafil 主要用於治療男性勃起功能障礙，由於口服 sildenafil citrate 其作用緩慢(需於性行為前 1 小時服用)，且口服之生體可用率僅 4% 因此如何改善此藥物的吸收速度及提高其生體可用率為本研究之重點。本研究擬開發出 sildenafil 以鼻腔內投予，其具有相當多的優點包括高生體可用率、低使用劑量、吸收迅速、快速達到藥理作用、降低副作用、投予方便及可免除因口服藥物所造成的腸肝首渡代謝效應。由於市售之 sildenafil 為 citrate 鹽類，其溶解度並無法滿足作為鼻噴劑之溶液，實驗中將以 sildenafil 為原料經適當的處理將其轉化成溶解較佳的類，並以此作為鼻噴劑(nasal spray solution)的藥物原料。除此之外本研究中 sildenafil 將藉由油水相乳液系統的技術製備出微米乳膠(microemulsion) 或奈米乳膠系統(nanoemulsion)成為快速吸收的鼻 腔給藥製劑，以改善作用緩慢且口服之生體可用率低的問題。本計畫將用相圖評估微米乳膠或奈米乳膠系統之形成，並進行乳膠劑型的特性評估，確定乳膠系統的處方組成與製備製程之後，添加 sildenafil 於乳膠系統內，使其成為含有 sildenafil 之鼻腔 給藥製劑，再分別針對乳膠系統的粒子分佈以及其安定性進行分析。Sildenafil 鼻噴劑 及微米乳膠(microemulsion) 或奈米乳膠系統製備後即進行動物臨床試驗藉以評估其投予動物體後之藥物動力學，藥動學試驗將包括 32 隻公的家兔以隨機方式平均分配成 8 組，每一組於試驗投予一種試驗藥物一次(試驗藥物為 ViagraR 50-mg tablet、Sildenafil 靜脈給藥之溶液及不同處方之鼻噴劑)，並於適當時間抽取血液檢品。此外藥 動學試驗將包含 16 位健康成年男性受試者，以隨機方式平均分配成 4 組，每一組於每 4 小時試驗投予一種試驗藥物一次(試驗藥物為 ViagraR 50-mg tablet 及 sildenafil 鼻噴 劑)，並於適當時間抽取血液檢品，並以高效液相層析儀分析 sildenafil 之血中濃度。藥 動學試驗結果將可得知以 sildenafil 及其經類轉化後，以鼻腔內投予之吸收速率是否優於口服方式投予，同時瞭解其相對生體可用率是否比口服投予高；此研究結果 將有助於此藥品於後續臨床試驗在設計上及實際生產之重要參考依據。</p>		

