

〔J. Pharm. Sci., 69, 1388 (1980)〕

**Preparation of Enteric-Coated Microcapsules for Tableting by
Spray-Drying Technique and *In Vitro* Simulation of Drug
Release from the Tablet in GI Tract**

HIDEO TAKENAKA, YOSHIAKI KAWASHIMA, SHAN YANG LIN

噴霧乾燥法による打錠用腸溶性マイクロカプセルの製造と消化管における
錠剤からの薬物溶出の *In Vitro* シミュレーション

竹中英雄, 川島嘉明, 林 山陽

噴霧乾燥法により打錠用腸溶性マイクロカプセルの製造に成功した。又、マイクロカプセルより製した錠剤からの薬物の溶出挙動を日本薬局方、崩壊試験器並びに新しく考案した消化管内での溶出の *in vitro* シミュレーター (Fig.) を使用して調べた。スルファメトキサゾールとセルロースアセテートフタレートのアモンニア水溶液に、コロイダルシリカ、タルク、モンモリロナイトクレイ等の添加剤を加えた懸濁液を噴霧乾燥する事により自由流動性のマイクロカプセルを得る事ができた。本マイクロカプセルは直接打錠が可能であった。生成マイクロカプセル内のスルファメトキサゾールは噴霧乾燥操作により結晶多形を生じⅠ型からⅡ型に変化する事が判明した。新しく考案した消化管内の錠剤からの薬物の溶出シミュレーターを使用すれば、従来の方法 (崩壊試験器等) では得ることができなかった溶出挙動を把握できる事が判明した。

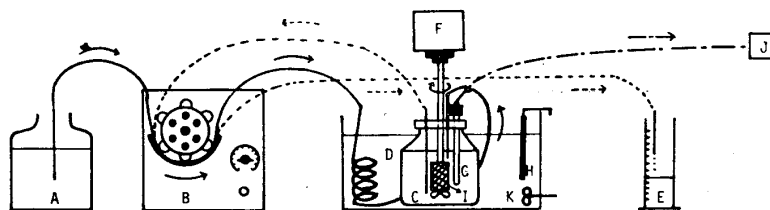


Figure —Apparatus for a new *in vitro* release simulator. Key: A, alkaline solution supplier; B, roller pump (1.27 ml/min); C, modified dissolution apparatus; D, water bath (37°); E, receiving reservoir; F, motor (94 rpm); G, pH electrode; H, heater; I, USP basket modified by attaching four-blade propeller; J, pH meter; K, stirrer; and — and ---, polyethylene tube plugged with cotton at initial points.