

[Drug Develop. Ind. Pharm., 9, 285 (1983)]

**Preparations of Solid Particulates of Aminophrine-Barbital Complex
(Pyrabital) without Autoxidation by a Spray Drying Technique**

YOSHIAKI KAWASHIMA, SHAN-YANG LIN, MASUMI UEDA,
HIDEO TAKENAKA

**噴霧乾燥法による自動酸化を防止したアミノピリン-バルビタール複合体
(ピラビタール) の造粒物の製造**

川島嘉明, 林 山陽, 植田真澄, 竹中英雄

pH が 5.46~8.01 の緩衝液にアミノピリン, バルビタール, コロイダルシリカを分散させた懸濁液を $130 \pm 5^\circ\text{C}$ で回転円盤法により噴霧乾燥した。噴霧乾燥供給液の pH が 5.70 から 7.24 の時には, 噴霧乾燥製品は, アミノピリン-バルビタールの複合体 (ピラビタール), アミノピリン及び添加物 (コロイダルシリカ) の混合物であった。pH が 5.84 より低い時には, 上記混合物にバルビタールが, pH 7.84 よりも高い時にはバルビタールナトリウムが共存することが判った。噴霧乾燥中にも生じるアミノピリンの自動酸化は, EDTA, グリシンのようなキレート剤や, チオ硫酸ナトリウム, クエン酸等を供給液に添加することにより効果的に防止できることが判明した。また供給液の pH を低くすることによりアミノピリンの自動酸化を防ぐことができた。噴霧乾燥製品は, いずれの条件下でも, 球状の造粒物となり, その粒子径は $4 \sim 30 \mu\text{m}$ の範囲にあった。またその粒度分布は対数正規分布則に従った。これらの製品は, いずれも直接打錠が可能であった。本法により, 反応, 乾燥, 造粒の 3 操作を同時に行うことができ, 製剤操作が飛躍的に改善された。

[Drug Develop. Ind. Pharm., 9, 1445 (1983)]

**Polymorphism and Drug Release Behavior of Spray-Dried Microcapsules
of Sulfamethoxazole with Polysaccharide Gum and Colloidal Silica**

YOSHIAKI KAWASHIMA, SHAN-YANG LIN, HIDEO TAKENAKA

**ポリサッカライドとコロイダルシリカを含有するスルファメトキサゾールの
噴霧乾燥マイクロカプセルの多形と溶出挙動**

川島嘉明, 林 山陽, 竹中英雄

ポリサッカライドガム, 例えばキサンタンガムやグアーガムを含むスルファメトキサゾールのマイクロカプセルを噴霧乾燥法により製した。コロイダルシリカを含む場合と含まない場合について薬物を溶解させたガムの水溶液またはアンモニア水溶液を $140 \pm 10^\circ\text{C}$ で, 回転円盤法 (40000rpm) により噴霧乾燥した。コロイダルシリカを含有する場合には, 噴霧乾燥製品の粒子径は増大し, 製錠のための流動性や充てん性が改善された。噴霧乾燥供給液にセルロースアセテートフタレート含有させると, スルファメトキサゾールの I, II 及び III の多形の混合物が得られることが明らかになった。キサンタンガムの水性及びアンモニア水溶液から製した乾燥品, グアーガムのアンモニア水溶液から製した乾燥品はいずれも多形の混合物であった。コロイダルシリカを含む製品はいずれの場合もスルファメトキサゾールの I 形であった。水溶液から製した製品からの薬物の放出速度は, アンモニア水溶液から製したものに較べ著しく減少することが判った。製品中のコロイダルシリカは, 水溶液からの製品の薬物放出速度を増大させたが, アンモニア水溶液からの製品の場合には減少効果を示した。