

〔Chem. Pharm. Bull., 30, 1900 (1982)〕

〔製剤学教室〕

Spherical Agglomeration of Aminophylline Crystals During Reaction in Liquid by The Spherical Crystallization Technique

YOSHIAKI KAWASHIMA, SHIGERU AOKI, HIDEO TAKENAKA

球形晶析法による液中での反応を伴うアミノフィリンの球形造粒

川島嘉明, 青木 茂, 竹中英雄

球形晶析法により, 反応中に生じたアミノフィリンの結晶を直接球状の造粒物にすることに成功した。クロロホルム, エタノール (又はメタノール), 水の混液にエチレンジアミンとテオフィリンを溶解させ, 系を攪拌することにより, 反応して析出したアミノフィリンの結晶が直ちに球形の造粒物に変化することを見い出した。造粒物は板状のアミノフィリン結晶からなり, テオフィリンとエチレンジアミンの含量割合は, 局方の規定に合致した。造粒物の平均粒子径は, 系の攪拌速度や系内の水分含量により変化した。攪拌速度が増大する程, 造粒物の平均粒子径は減少した。又, 系内の添加水分量が多い程, 造粒物の平均粒子径は増大した。然しながら, 系内の水分量が多すぎると, 造粒物はペースト状になった。溶媒にメタノールよりもエタノールを使用した場合の方が, 攪拌速度や水分添加量が造粒物の粒子径に及ぼす影響が強いことが判った。

〔Chem. Pharm. Bull., 30, 1837 (1982)〕

〔製剤学教室〕

Direct Agglomeration of Sodium Theophylline Crystals Produced by Salting Out in Liquid

YOSHIAKI KAWASHIMA, SHAN-YANG LIN, MASAFUMI NAITO

HIDEO TAKENAKA

液中での塩析により生じたテオフィリンナトリウムの直接造粒

川島嘉明, 林 山陽, 内藤雅文, 竹中英雄

テオフィリンのエチレンジアミン水溶液に, 塩化ナトリウム水溶液を加えると, テオフィリンナトリウムの1水和物が析出することが判った。ここへ, さらにエタノールとクロロホルムを適当な組成割合で添加すると, 結晶が凝集したり, 造粒物になることが判った。系内のクロロホルム分率を徐々に増大させると, 結晶の沈降体積は徐々に増大するが, クロロホルム分率が41%附近で急激に減少した。これは, 結晶が凝集物から造粒物に変化したためである。クロロホルム分率をさらに増大させると, 造粒物同志が造粒し始め, 沈降体積は再び増大した。56%附近で結晶がすべてマクロペレットに変化するため, 沈降体積は再び急激に減少した。この様にクロロホルム分率により造粒挙動は著しく変化した, 造粒物を構成している結晶の形や大きさは全く変化しないことが判った。