

· 译文与文摘 ·

喷雾干燥法制备可直接压片的茶硷 —苯巴比妥粉末混合物及复合物

采用喷雾干燥技术因溶剂蒸发迅速,已广泛用于加工对热敏感的食品、化工制品、药品干燥的有效方法。苯巴比妥与茶硷合用,它有抑制茶硷对中枢神经的兴奋作用。研究喷雾干燥法直接制备可压性茶硷—苯巴比妥固体微粒的混合物,将为制药工艺提供许多方便。为避免吸收缓慢和生物利用度较差的茶硷—苯巴比妥复合物形成,本文研究在喷雾干燥过程中影响复合物形成的因素。

方法:用硅胶(0~15g)及甲基纤维素(0~2.0g)作为茶硷(10.5~21g)和苯巴比妥(9~13.5g)的赋形剂,加水或2.8%氢氧化铵搅动20分钟使成匀浆,用3000转/分的离心旋转喷雾器,以20~33ml/分的速度喷入可调温的干燥器中(调至 $90\sim 145^{\circ}\pm 5^{\circ}\text{C}$),成品用旋风收集器收集。

药物含量测定及鉴别:采用岛津556型分光光度计,于波长280nm处,蒸馏水作溶剂测定茶硷。为消除茶硷的吸收,于0.1N氢氧化钠溶液中,在双光束分光光度计上,以256和288.3nm处测定苯巴比妥。茶硷在256和288.3nm波长处其克分子吸收系数均为 5.69×10^3 ,而苯巴比妥在此波长处克分子吸收系数分别为 7.33×10^3 和418。测定苯巴比妥的标准校正曲线方程为: $y = 0.0305x +$

0.0022

y : 在256与288.3nm处的吸收差; x : 苯巴比妥的浓度($\mu\text{g/ml}$)。

用红外分光光度计和x射线分析进行成品鉴别。以扫描差热分析仪(DSC 日本理学公司产品)作茶硷—苯巴比妥的相图,测定参比物质中茶硷与苯巴比妥的比例,以检定产品。将各种不同比例的茶硷—苯巴比妥的混合物置于一烧杯中,渐热至熔融,冷至室温,然后将重新固化的细粉,以扫描差热分析仪中加热,加热速度为 $10^{\circ}\text{C}/\text{分}$,由所取的数据建立茶硷—苯巴比妥相图。用此相图来鉴别产品复合物中茶硷与苯巴比妥的比例。

结论:用水制作匀浆的产品主要为茶硷和苯巴比妥的物理混合物,其中混有少量的分子复合物;而用氢氧化铵制作匀浆的产品主要为茶硷和苯巴比妥的分子复合物。影响产品中分子复合物数量的因素,主要是硅胶或甲基纤维素的量和配方中茶硷与苯巴比妥的组成比例,干燥温度也有一定的影响。

[International Journal of Pharmacuetics 18 (1984) 335—343 (英文)第三军医大学附二院药局 徐传福摘译 刘春及校]