

血塞通口腔崩解片的制备及质量标准研究

★ 刘志承 冯浩 何泰东 (广东省深圳市中医院药剂科 深圳 518020)

关键词:口腔崩解片;血塞通;三七总皂苷

中图分类号:R 284.1 文献标识码:B

血塞通口腔崩解片是由我国中药部颁标准第17册收录的血塞通片改变剂型而得。血塞通片是三七总皂苷加适量赋形剂制成的片剂,每片含三七总皂苷为25 mg。具有活血祛瘀,通脉活络,抑制血小板聚集和增加脑血流量的作用。用于脑络瘀阻,中风偏瘫,心脉瘀阻,胸痹心痛;脑血管病后遗症,冠心病心绞痛属上述证候者。目前还未见血塞通口腔崩解片的研制报道。口腔崩解片(rapidly disintegrating oral tablets),具有服用方便、起效快、生物利用度高等特点。将已有中成药片剂制成口腔崩解片,可以提高中药的使用顺应性,促进中药剂型的改革。

1 仪器与试剂

日立U-3000紫外仪;ZRS-4型智能溶出仪,天津大学无线电厂;三七总皂苷(云南玉溪万方天然药物有限公司);甘露醇(青岛胶南明月海藻工业有限责任公司);微晶纤维素、羟丙基纤维素(低取代)(浙江湖州展望化学药业有限公司);其他试剂均为分析纯。

2 处方和制备工艺

2.1 处方 取处方量三七总皂苷25 g、甘露醇25 g、微晶纤维素40 g、羟丙基纤维素(低取代)10 g、硬脂酸镁1 g、聚乙烯吡咯烷酮QS,共制成1000片。

2.2 制备方法 取处方量的三七总皂苷、甘露醇、微晶纤维素、羟丙基纤维素(低取代)研细,过80目筛,混合均匀,将聚乙烯吡咯烷酮溶于适量50%乙醇中作为粘合剂,制成软材,湿法制粒,60℃鼓风烘干,过筛后,加硬脂酸镁,整粒,混匀,压片,即得。

3 质量控制

3.1 性状 本品为白色或微黄色片。

3.2 鉴别 取本品,除去糖衣,研细,加甲醇制成1 mL中含10 mg的溶液,滤过,滤液作为供试品溶液。另取人参皂苷Rb1、Rg1及三七皂苷R1对照品,加甲醇制成每1 mL各含2 mg的混合溶液,作为对照品溶液。照薄层色谱法(中国药典2005年版附录VI B)试验,吸取上述两种溶液各5 μL,分别点于同一硅胶H薄层板上,以氯仿-甲醇-水(7:3:0.5)为展开剂,展开,取出,晾干,喷以硫酸乙醇溶液(1→10),于105℃烘约10分钟。供试品色谱中,在与对照品色谱相应的位置上显相同颜色的斑点。

3.3 崩解时限 我国对口腔崩解片作了如下的技术规定:(1)应在口腔内迅速崩解,无沙砾感、口感良好、容易吞咽,对口腔黏膜无刺激性,并订入质量标准中性状项。(2)建立合适的崩解时限测定方法和限度,并订入质量标准。(3)对难溶性药物,应建立合适的溶出度测定方法和限度,并订入质

量标准。本品的崩解时限检测方法是:取本品1片,置盛有5 mL水的试管中,轻微振摇,1分钟应全部崩解并通过20目筛。

3.4 含量测定^[1] 用比色法测定本品中三七总皂苷的含量。

(1)测定波长的选择。取三七总皂苷对照品适量,照样品测定方法加甲醇制成溶液,按分光光度法(中国药典一部附录V A)测定,在560 nm波长处有最大吸收,故确定检测波长为560 nm。

(2)样品测定方法。取本品20片,精密称定,研细,精密称取适量(约相当于三七总皂苷23 mg),置25 mL量瓶中,加甲醇溶解并稀释至刻度,摇匀,用干燥滤纸滤过,弃去初滤液,精密量取续滤液2 mL,置25 mL量瓶中,加甲醇稀释至刻度,摇匀。精密量取上述配好的本品甲醇溶液2 mL于试管中,同时做一空白管,在水浴上蒸干,冷至室温,加5%香荚兰醛冰醋酸溶液0.2 mL,加0.8 mL高氯酸,在70℃热水浴中显色15分钟,放冷,加冰醋酸5 mL,摇匀,在560 nm波长测定吸收度。同时用三七总皂苷对照品经60℃真空干燥2小时后按样品同样操作,测定吸收度,按下式计算供试品中三七总皂苷含量:

$$\text{三七总皂苷}(\%) = \frac{\text{样品吸收度} \times \text{对照品重} \times \text{平均片重}}{\text{对照品吸收度} \times \text{样品重} \times \text{标示量}} \times 100\%$$

(3)测定结果:三七总皂苷含量分别为24.7%、24.8%、24.9%。

(4)精密度实验:精密吸取上述对照品溶液重复进样5次。RSD为1.88%。

(5)回收率实验:取样品分别加不同量的对照品,按上述含量测定方法进行测定($n=9$),结果平均回收率为100.2%,RSD=0.4%。

4 讨论

血塞通口腔崩解片可方便部分人群用药,如老人、吞咽困难或特殊环境下的病人。该剂型与普通片剂相比其特点为:不需用水或只需少量水,无需咀嚼,药物置于舌上,遇唾液迅速崩解后,借吞咽动作起效。提高了中药成分的溶散性和溶出速率。控制产品的质量方法是通过TLC方法鉴别三七总皂苷和比色方法测定三七总皂苷的含量。

参考文献

[1]马萍,辛艳茹,高文静,等.口腔速崩片的研究进展[J].中国药师,2004,7(3):173~175

(收稿日期:2006-10-13)