



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 104398935 A

(43) 申请公布日 2015. 03. 11

(21) 申请号 201410760593. 1

(22) 申请日 2014. 12. 13

(71) 申请人 黑龙江江恒医药科技有限公司

地址 154800 黑龙江省哈尔滨市依兰县新楼
街 23 号

(72) 发明人 不公告发明人

(51) Int. Cl.

A61K 36/902(2006. 01)

A61K 9/20(2006. 01)

A61P 9/14(2006. 01)

权利要求书1页 说明书3页

(54) 发明名称

一种化痔片及其制备方法

(57) 摘要

本发明公开了一种化痔片及其制备方法, 其特征在于取牛蒡子 10g, 薏苡仁 50g, 槐米 200g, 茜草 250g, 枳壳 250g, 三棱 250g, 采用二氧化碳超临界萃取法提取, 减压干燥, 用高能纳米冲击磨粉碎成纳米干膏, 加入功能性辅料, 制成化痔片, 崩解时间显著缩短, 疗效显著优于市售化痔片, 取得了积极效果。

1. 一种治疗内痔,外痔,混合痔,内外痔血栓疾病的中药,其特征是取牛蒡子 10g, 薏苡仁 50g, 槐米 200g, 茜草 250g, 枳壳 250g, 三棱 250g, 粉碎成 60 目粗粉,采用二氧化碳超临界萃取法提取,萃取压力 20 ~ 40Mpa,萃取温度 20 ~ 40℃,分离器压力 15 ~ 25Mpa,分离器温度 40 ~ 60℃,分离时间 2 ~ 4 小时,二氧化碳流量每小时 20 ~ 40L,得提取液;取提取液 60℃~ 80℃减压干燥,得干膏;取干膏加入果糖 80 ~ 120g,采用高能纳米冲击磨粉碎成粒径 200 ~ 300nm 的混合干膏粉;取混合干膏粉,微晶纤维素 35 ~ 45g,交联聚乙烯吡咯烷酮 35 ~ 45g,交联羧甲基纤维素钠 35 ~ 45g,羟丙甲纤维素 25 ~ 35g,微粉硅胶 15 ~ 25g,混合均匀,用 50 ~ 70% 乙醇湿法制粒,60℃~ 80℃干燥,外加亮氨酸 7 ~ 9g,整粒,压片,制得化痔片。

2. 根据权利要求 1 所述中药的制备方法,其特征是取牛蒡子 10g, 薏苡仁 50g, 槐米 200g, 茜草 250g, 枳壳 250g, 三棱 250g, 粉碎成 60 目粗粉,采用二氧化碳超临界萃取法提取,萃取压力 20 ~ 40Mpa,萃取温度 20 ~ 40℃,分离器压力 15 ~ 25Mpa,分离器温度 40 ~ 60℃,分离时间 2 ~ 4 小时,二氧化碳流量每小时 20 ~ 40L,得提取液;取提取液 60℃~ 80℃减压干燥,得干膏;取干膏加入果糖 80 ~ 120g,采用高能纳米冲击磨粉碎成粒径 200 ~ 300nm 的混合干膏粉;取混合干膏粉,微晶纤维素 35 ~ 45g,交联聚乙烯吡咯烷酮 35 ~ 45g,交联羧甲基纤维素钠 35 ~ 45g,羟丙甲纤维素 25 ~ 35g,微粉硅胶 15 ~ 25g,混合均匀,用 50 ~ 70% 乙醇湿法制粒,60℃~ 80℃干燥,外加亮氨酸 7 ~ 9g,整粒,压片,制得化痔片。

3. 根据权利要求 1 所述中药的制备方法,取牛蒡子 10g, 薏苡仁 50g, 槐米 200g, 茜草 250g, 枳壳 250g, 三棱 250g, 粉碎成 60 目粗粉,采用二氧化碳超临界萃取法提取,萃取压力 30Mpa,萃取温度 30℃,分离器压力 20Mpa,分离器温度 50℃,分离时间 3 小时,二氧化碳流量每小时 30L,得提取液;取提取液 70℃减压干燥,得干膏;取干膏加入果糖 100g,采用高能纳米冲击磨粉碎成粒径 200 ~ 300nm 的混合干膏粉;取混合干膏粉,微晶纤维素 40g,交联聚乙烯吡咯烷酮 40g,交联羧甲基纤维素钠 40g,羟丙甲纤维素 30g,微粉硅胶 20g,混合均匀,用 60% 乙醇湿法制粒,70℃干燥,外加亮氨酸 8g,整粒,压片,制得化痔片。

一种化痔片及其制备方法

技术领域

[0001] 本发明涉及中药领域,具体涉及一种化痔片及其制备方法。

背景技术

[0002] 化痔片清热,凉血,止血,行气散瘀。用于内痔,外痔,混合痔,内外痔血栓。市售化痔片由于组方和工艺原因,疗效不甚理想,制剂采用传统工艺制备,存在崩解迟缓、疗效低等不足。

发明内容

[0003] 本发明为克服上述不足,提供一种崩解速度快、疗效高的化痔片及其制备方法。

[0004] 发明实施方案如下:

取牛蒡子 10g, 薏苡仁 50g, 槐米 200g, 茜草 250g, 枳壳 250g, 三棱 250g, 粉碎成 60 目粗粉,采用二氧化碳超临界萃取法提取,萃取压力 20 ~ 40Mpa, 萃取温度 20 ~ 40℃, 分离器压力 15 ~ 25Mpa, 分离器温度 40 ~ 60℃, 分离时间 2 ~ 4 小时,二氧化碳流量每小时 20 ~ 40L, 得提取液;取提取液 60℃ ~ 80℃减压干燥,得干膏;取干膏加入果糖 80 ~ 120g, 采用高能纳米冲击磨粉碎成粒径 200 ~ 300nm 的混合干膏粉;取混合干膏粉,微晶纤维素 35 ~ 45g, 交联聚乙烯吡咯烷酮 35 ~ 45g, 交联羧甲基纤维素钠 35 ~ 45g, 羟丙甲纤维素 25 ~ 35g, 微粉硅胶 15 ~ 25g, 混合均匀,用 50 ~ 70% 乙醇湿法制粒,60℃ ~ 80℃干燥,外加亮氨酸 7 ~ 9g, 整粒,压成 1000 片,制得化痔片。

[0005] 上述实施方案所提到的原材料标准如下:

牛蒡子:中国药典 2005 年版一部标准。本品为菊科植物牛蒡 *Arctium lappa* L. 的干燥成熟果实。秋季果实成熟时采收果序,晒干,打下果实,除去杂质。再晒干。

[0006] 薏苡仁:中国药典 2005 年版一部标准。本品为禾本科植物薏苡 *Coix lacryma-jobi* L. var. *ma-yuen* (Roman.) Stapf 的干燥成熟种仁。秋季果实成熟时采割植株,晒干,打下果实,再晒干,除去外壳、黄褐色种皮及杂质,收集种仁。

[0007] 槐米:中国药典 2005 年版一部标准。本品为豆科植物槐 *Sophora japonica* L. 的干燥花及花蕾。夏季花开放或花蕾形成时采收,及时干燥,除去枝、梗及杂质。前者习称“槐花”,后者习称“槐米”。

[0008] 茜草:中国药典 2005 年版一部标准。本品为茜草科植物茜草 *Rubia cordifolia* L. 的干燥根及根茎。春、秋二季采挖,除去泥沙,干燥。

[0009] 枳壳:中国药典 2005 年版一部标准。本品为芸香科植物酸橙 *Citrus aurantium* L. 及其栽培变种的干燥未成熟果实。7 月果皮尚绿时采收,自中部横切为两半,晒干或低温干燥。

[0010] 三棱:中国药典 2005 年版一部标准。本品为黑三棱科植物黑三棱 *Sparganium stoloniferum* Buch — Ham. 的干燥块茎。冬季至次年春采挖,洗净,削去外皮,晒干。

[0011] 果糖:中国药典 2010 年版二部标准。

[0012] 微晶纤维素:中国药典 2010 年版二部标准。

[0013] 交联聚乙烯吡咯烷酮:中国药典 2010 年版二部标准。

[0014] 交联羧甲基纤维素钠:中国药典 2010 年版二部标准。

[0015] 羟丙甲纤维素:中国药典 2010 年版二部标准。

[0016] 微粉硅胶:中国药典 2010 年版二部标准。

[0017] 亮氨酸:中国药典 2010 年版二部标准。

[0018] 以上化痔片所用到的原材料均可从医药公司购买得到,只要满足国家标准均可用来实施本发明方案。

[0019] 上述发明方案中所用术语为药学专用术语,如“减压”等皆遵从中国药典规定和相关药学规范。

[0020] 本发明中的单位 g 也可以是其它重量份,不影响本发明方案的实施。

[0021] 本发明方案中所述的设备市场均有销售,并不限于典型生产厂家,只要技术指标能够达到要求,均可用来实现本发明。

[0022] 四 具体实施方式

本发明的具体实施例 1

取牛蒡子 10g, 薏苡仁 50g, 槐米 200g, 茜草 250g, 枳壳 250g, 三棱 250g, 粉碎成 60 目粗粉,采用二氧化碳超临界萃取法提取,萃取压力 20Mpa,萃取温度 20℃,分离器压力 15Mpa,分离器温度 40℃,分离时间 2 小时,二氧化碳流量每小时 20L,得提取液;取提取液 60℃减压干燥,得干膏;取干膏加入果糖 80g,采用高能纳米冲击磨粉碎成粒径 200 ~ 300nm 的混合干膏粉;取混合干膏粉,微晶纤维素 35g,交联聚乙烯吡咯烷酮 35g,交联羧甲基纤维素钠 35g,羟丙甲纤维素 25g,微粉硅胶 15g,混合均匀,用 50% 乙醇湿法制粒,60℃干燥,外加亮氨酸 7g,整粒,压成 1000 片,制得化痔片。

[0023] 本发明的具体实施例 2

取牛蒡子 10g, 薏苡仁 50g, 槐米 200g, 茜草 250g, 枳壳 250g, 三棱 250g, 粉碎成 60 目粗粉,采用二氧化碳超临界萃取法提取,萃取压力 40Mpa,萃取温度 40℃,分离器压力 25Mpa,分离器温度 60℃,分离时间 4 小时,二氧化碳流量每小时 40L,得提取液;取提取液 80℃减压干燥,得干膏;取干膏加入果糖 120g,采用高能纳米冲击磨粉碎成粒径 200 ~ 300nm 的混合干膏粉;取混合干膏粉,微晶纤维素 45g,交联聚乙烯吡咯烷酮 45g,交联羧甲基纤维素钠 45g,羟丙甲纤维素 35g,微粉硅胶 25g,混合均匀,用 70% 乙醇湿法制粒,80℃干燥,外加亮氨酸 9g,整粒,压成 1000 片,制得化痔片。

[0024] 本发明的具体实施例 3

取牛蒡子 10g, 薏苡仁 50g, 槐米 200g, 茜草 250g, 枳壳 250g, 三棱 250g, 粉碎成 60 目粗粉,采用二氧化碳超临界萃取法提取,萃取压力 30Mpa,萃取温度 30℃,分离器压力 20Mpa,分离器温度 50℃,分离时间 3 小时,二氧化碳流量每小时 30L,得提取液;取提取液 70℃减压干燥,得干膏;取干膏加入果糖 100g,采用高能纳米冲击磨粉碎成粒径 200 ~ 300nm 的混合干膏粉;取混合干膏粉,微晶纤维素 40g,交联聚乙烯吡咯烷酮 40g,交联羧甲基纤维素钠 40g,羟丙甲纤维素 30g,微粉硅胶 20g,混合均匀,用 60% 乙醇湿法制粒,70℃干燥,外加亮氨酸 8g,整粒,压成 1000 片,制得化痔片。

[0025] 以上实施例说明,采用本发明实施方案的极端条件和优化条件均能制成化痔片。

下面以实施例 3 制得的化痔片考察本发明的实际效果：

(一) 实施例 3 化痔片与市售化痔片崩解时限对比

1 崩解时限测定方法

按中国药典 2010 年版附录 XII A 测定。

[0026] 2 崩解时限对比

表 1 实施例 3 化痔片和市售化痔片崩解时限对比表

药品名称	崩解时限
实施例 3 化痔片	5 分钟
市售化痔片	18.5 分钟

上述结果表明，本发明制备的化痔片相对于市售化痔片具有崩解速度快、生物利用度高等显著优点。

[0027] (二) 实施例 3 化痔片与市售化痔片治疗内痔，外痔，混合痔，内外痔血栓疾病临床疗效观察

1 病例情况

统计门诊和住院病例，共观察内痔，外痔，混合痔，内外痔血栓疾病病例 120 例，平均年龄 39 岁。将患者分为两组，试验组服用实施例 3 化痔片，对照组服用市售化痔片。

[0028] 2 疗效评定标准

依据中药新药临床研究指导原则中医证候疗效判定标准：

临床痊愈：中医临床症状、体征消失或基本消失，证候积分减少 $\geq 95\%$ 。

[0029] 显效：中医临床症状、体征明显改善，证候积分减少 $\geq 70\%$ 。

[0030] 有效：中医临床症状、体征均有好转，证候积分减少 $\geq 30\%$ 。

[0031] 无效：中医临床症状、体征均无明显改善或者加重，证候积分减少 $< 30\%$ 。

[0032] 计算公式： $[(\text{治疗前积分} - \text{治疗后积分}) \div \text{治疗前积分}] \times 100\%$ 。

[0033] 3 临床观察结果

表 2 实施例 3 化痔片和市售化痔片临床疗效对比表

药品名称	痊愈	显效	有效	无效	总有效率
实施例 3 化痔片	17	26	12	5	91.67%
市售化痔片	14	20	9	17	71.67%

上述临床疗效观察结果表明，本发明制备的化痔片在治疗内痔，外痔，混合痔，内外痔血栓疾病时疗效显著高于市售化痔片， $p < 0.05$ 。