



[12]发明专利申请公开说明书

[21]申请号 93104370.0

[51]Int.Cl⁵

[43]公开日 1994年10月26日

A61K 9/00

[22]申请日 93.4.22

[71]申请人 孟丽君

地址 150036黑龙江省哈尔滨市香坊区中山路
110号省医院药研所

[72]发明人 孟丽君

A61K 37/40 A61K 47/32

A61M 37/00

说明书页数:

附图页数:

[54]发明名称 表面麻醉涂膜剂的制备方法

[57]摘要

本发明涉及麻醉涂膜剂的制备方法，是一种加入麻醉剂、抑菌剂和血管收缩剂的表面麻醉涂膜剂配制方法。由于目前美容手术中所用的麻醉剂，药物含量大，麻醉效果差，还有产生毒性作用的危险。本发明将麻醉剂（盐酸丁卡因或利多卡因）、醋酸洗必泰、肾上腺素、透皮促进剂（丙二醇、二甲基亚砜、薄荷脑等）、可溶性高分子成膜材料（PVA、CMC等）、乙醇、蒸馏水按一定比例混合，配成含麻醉剂（盐酸丁卡因或利多卡因）1.0~5.0%的表面涂膜剂。这种新的麻醉剂能很快穿透皮肤表面，使麻醉效果明显提高，并具有抗感染，减少药物毒性的作用。

权 利 要 求 书

1. 一种表面麻醉涂膜剂的制备方法，其特征在于：将水溶性高分子成膜材料(PVA、CMC等)按比例与蒸馏水混合，充分溶胀后加热溶解(低于95℃)，冷却至60℃左右得胶体溶液(I)，另将盐酸丁卡因(或利多卡因)、醋酸洗必泰、盐酸肾上腺素及丙二醇(或二甲基亚砜、薄荷脑等)按一定比例溶于乙醇溶液中，得药物乙醇溶液(II)，在搅拌下将(II)加到(I)内，混合均匀后冷却至室温制成。

2. 按照权利要求1所述配制方法，其特征在于：配制时，各种成份按体积计算，其份数比例为：

$$(I) : (II) = 20 \sim 30 : 70 \sim 80.$$

3. 按照权利要求1和2所述配制方法，其特征在于：配制后各种成份的百分含量w/v(%)为：

盐酸丁卡因(或利多卡因)1.0~5.0，成膜材料(PVA、CMC等)2~3，醋酸洗必泰0.05~0.1，盐酸肾上腺素0.0005~0.001，丙二醇(或二甲基亚砜、薄荷脑等)5~15，乙醇45~55，蒸馏水30~50。

说 明 书

表面麻醉涂膜剂的制备方法

本发明涉及涂膜剂的制备方法，是一种加入麻醉剂，抑菌剂和血管收缩剂的表面麻醉涂膜剂配制方法。

目前美容及临床手术中，常采用表面麻醉，常用麻醉剂为10~20%利多卡因喷雾剂和2~10%丁卡因溶液剂，由于这两种麻醉剂都有产生毒性作用的危险，尤其在纹眼线时，极易造成角膜损伤。丁卡因溶液剂麻醉效果差，含量大时毒性增强。利多卡因喷雾剂麻醉效果较好，但毒性大，配制时需特殊设备，成本较高。

针对上述麻醉剂存在的问题以及美容手术中，表面麻醉的需要，本发明的目的在于提供一种表面麻醉涂膜剂的配制方法，即将麻醉剂、抑菌剂、透皮促进剂、血管收缩剂、可溶性高分子成膜材料、乙醇和水按比例配制成表面麻醉涂膜剂，使新配制的这种涂膜剂，涂于皮肤表面后很快形成一薄膜，药物能快速穿透皮肤表面，增强麻醉效果，减少毒副作用并能预防局部感染，是美容及临床手术较理想的麻醉剂。

本发明的技术手段是，将一定量的水溶性高分子成膜材料(PVA、CMC等)加到蒸馏水中，充分溶解后加热(低于95℃)使其完全溶解，制得胶体溶液(I)。另将麻醉剂(盐酸丁卡因或利多卡因)、醋酸洗必泰、盐酸肾上腺素、透皮促进剂(丙二醇、薄荷脑、二甲基亚砜等)按一定比例溶于乙醇溶液中，得到药物乙醇溶液(II)。然后将(II)在搅拌下加到保温在60℃左右的(I)中，混和均匀后，冷却至室温既可。在其配制过程中，各种成份的用量按体积计算，其份数比例为：

$$(I) : (II) = 20 \sim 30 : 70 \sim 80$$

配制后各种成份的百分含量W/V(%)为：麻醉剂1.0~5.0，醋酸洗必泰0.05~0.1，成膜材料2~3，透皮促进剂5~15，盐酸肾上腺素0.0005~0.001，乙醇45~55，蒸馏水30~50。

采用本发明的配制方法制得的表面麻醉涂膜剂，降低了麻醉剂的含量，提高了麻醉效果，临床用于美容手术336例，其中重睑术60例，纹眼线240例，纹唇线12例，纹眉24例，证明麻醉效果好，操作简便，用量小，成本低，对皮肤无不良反应。

实施例一：

将PVA-1750 2.7g 加到30ml蒸馏水中，充分溶涨后加热至80℃，完全溶解后冷却至60℃左右，得胶体溶液，另将丙二醇10ml，盐酸丁卡因2.5g，醋酸洗必泰0.1g，盐酸肾上腺素1mg，依次溶于60ml 80%乙醇溶液，混合均匀后，在搅拌下加到胶体溶液内，混合均匀，冷却至室温即制得丁卡因含量为2.5%的表面麻醉涂膜剂。

实施例二：

将PVA-1750 2.5g 与30ml蒸馏水混合，充分溶涨后加热至80℃ 完全溶解，冷却至60℃ 左右，得胶体溶液，另将丙二醇12ml，利多卡因5.0g，醋酸洗必泰0.05g，盐酸肾上腺素0.5mg，依次溶于58ml 75%乙醇溶液内，混合均匀在搅拌下加到胶体溶液内，混合均匀后，冷却至室温即制得利多卡因含量为5.0%的表面麻醉涂膜剂。