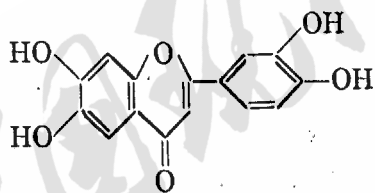


对中国药典(1977)制备筋骨草片方法的商榷

温州市医药总公司 陈光表

中国药典(1977, 一部)规定制备筋骨草片的植物为唇形科植物筋骨草(*Ajuga decumbens* Thunb)别名白毛夏枯草的干燥全草, 它含有黄酮甙、黄酮类[木犀草素(Luteolin)]、皂甙、生物碱、有机酸、鞣酸、酚性物质、甾体化合物、还原糖和无机盐等成份。甾体化合物中主要为杯苋甾酮(Cyasterone)、蜕皮甾酮(Ecdysterone)及微量的筋骨草甾酮 C (*Ajugasterone* C)等昆虫变态激素。还含有抗雌激素作用的筋骨草内酯(*Ajugalactone*)。根内含筋骨草糖(*Kiransin*)^[1,2,3]。



木犀草素

筋骨草片的二种生产工艺分析

从其化学成份与药理作用的研究, 得知黄酮甙和黄酮类(木犀草素)是筋骨草的主要有效成分之一, 因此在制备其片剂时, 必须注意对这些有效成份的提取。中国药典(1977)规定的制备筋骨草片的醇提水沉法便是根据黄酮甙既溶于醇又溶于水的特性。但药典法规定取生药2400克, 经醇提、水沉、浓缩得稠膏约600克(比重为1.3°左右), 进一步浓缩有困难, 加入规定量的生药细粉100克(膏:粉为6~6.5:1), 混和后仍呈浆糊状, 以致制粒困难。如在85℃以下干燥, 则费时长、耗能大, 同时还需耗用大量酒精, 从生产成本与安全

操作角度来看都有所不取。中国药典(1985)已不收录此品种。

另一生产路线为水煎醇沉法^[4]。这也是根据黄酮甙溶于水或醇的特性, 此法是取生药全量的10%粉碎成细粉, 另取其90%量再水煎提, 水提液浓缩后加乙醇沉淀, 取上清液浓缩成稠膏(比重为1.3°左右), 加入上述10%的细粉和适量辅料, 由于加入稠膏中的生药细粉比例较高(膏:粉为1.8:1), 混和后容易制粒与压片。用水煎提时能将黄酮甙、生物碱盐、有机酸类, 以及其他非活性杂质如淀粉、树脂、果胶、粘液质、蛋白质及鞣质等提取出来, 加醇沉淀时能将这些杂质除去^[5], 而用药典的醇提水沉法时, 则正好相反, 但黄酮甙最后均存留在溶液中。故二法对有效成份黄酮甙的提取, 可说是殊途同归, 几无区别。

二种生产方法的薄层层析试验

按水煎醇沉法和药典法分别制得颗粒I和颗粒II, 各取其相当一片量, 用甲醇10ml振摇提取, 过滤, 取滤液5μl点样进行薄层层析, 吸附剂为硅胶G, 薄层板置110℃活化2小时, 分别用下列三种展开剂展开, 展开完毕, 置紫外光灯(365nm)下观察荧光斑点。

(1) 取冰醋酸-水(12:88)的混和液作展开剂, 层析结果见图1。

(2) 取氯仿-冰醋酸-水(13:6:1)的混和液, 充分振摇后分取氯仿层作展开剂, 层析结果见图2。

(3) 取正丁醇-冰醋酸-水(4:1:5)的混和液振摇后分取正丁醇层作展开剂, 层

析结果见图3。

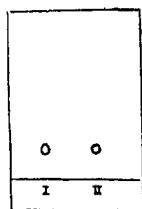


图1

斑点为淡黄色荧光

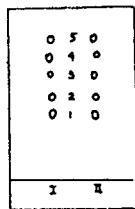


图2

斑点1.2为淡黄色荧光 3.4.5极淡兰绿色荧光

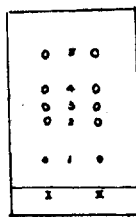


图3

斑点1.细小、淡黄绿色荧光 2.3.4淡黄色荧光 5.极淡兰绿色荧光

图1的斑点可能为黄酮甙类化合物，图2、3的斑点可能为黄酮类(黄酮甙元)化合物。二种生产方法所显斑点的位置基本相同。(三种展开剂中以(2)的分离效果较好)。

筋骨草片的临床疗效

嘉兴、湖州、安吉、平湖等药厂按水煎醇沉法所制得的筋骨草片治疗老年性慢性支气管炎，急性扁桃体炎，肺炎等361例，总有效率达85%，显效为40%；由温州中药厂按同法生产的片剂治疗上感、急性扁桃体炎、疖肿等84例，有效率达85.6%。另外，筋骨草民间习用水煎成汤剂服用，疗效卓著，据报导，用其水煎剂治疗老慢支577例，有效率达81%；另用其水煎剂治疗急性气管炎、肺炎、肺脓疡、扁桃体炎、因喉炎及胆道感染等也颇见功效^[8]。因此，筋骨草经水煎或水煎醇沉所制得的汤剂或片剂，临床疗效确切，表明其有效成份已被充分提取出来。

从以上生产工艺分析、层析实验以及临床疗效来看，水煎醇沉法和药典法对黄酮甙

和黄酮类等有效成份的提取，基本相似。而从制粒、压片的可行性、生产安全性及成本的降低方面，前法有过之而无不及，何乐不为呢？

讨论

筋骨草的有效成份之一木犀草素具有微溶于水而溶于乙醇和碱性或弱碱性水溶液中的特性^[7,8]，故水煎醇沉法或药典法对于木犀草素的提取，从理论上说都不尽合理。如果用碱性溶液提取，则又恐生物碱类丢失或黄酮甙类水解。因此应进一步探索更合理的提取工艺。但水煎醇沉法所制得的片剂既然疗效肯定，说明其有效成份(包括部份木犀草素)已基本被提取出来，在当前尚未有更良好的提取工艺之前，此法仍不可失之东隅。

参考文献

- [1] 江苏新医学院编：中药大辞典，上海科学技术出版社 1986，P.752。
- [2] 国家医药管理局中草药情报中心站编：植物药有效成份手册，人民卫生出版社，1986，P.680。
- [3] 全国中草药汇编(上册) 人民卫生出版社 1975，P.857。
- [4] 安徽省新安江制药厂：中草药通讯 1973，(1)：53。
- [5] 南京药学院药剂学教研室编：药剂学(第2版)。人民卫生出版社，1985，P.471~472。
- [6] 南京市卫生教育馆：中草药单方、验方新医疗法汇编，1971，P.67。
- [7] The Merck Index (Tenth ed) 1983, 5422。
- [8] 日本化学大辞典(Encyclopaedia Chimica) 昭和56年 (9)，P.845。