

· 医院药学 ·

盐酸达克罗宁口含片的研制¹

朱健平 (广东医学院药理教研室, 湛江 524023)

陈华萍 (广东医学院附属医院药剂科, 湛江 524023)

朱颖 (中国药科大学药剂教研室, 南京 210009)

王菊岩 (广东医学院附属医院胃镜室, 湛江 524023)

摘要 研制了盐酸达克罗宁口含片。用紫外分光光度法测定制剂中盐酸达克罗宁的含量, 结果表明浓度在 4 $\mu\text{g}/\text{ml}$ ~16 $\mu\text{g}/\text{ml}$ 范围内具有良好的线性关系, 制剂辅料对测定无干扰, 平均回收率为99.20 $\pm$ 0.62%。

关键词 盐酸达克罗宁 含片 含量测定

上消化道内窥镜检查的术前用药, 目前国内普遍采用地卡因、利多卡因或达克罗宁等局麻药喷雾剂对病人咽喉部进行喷雾麻醉的方法^[1]。该剂型操作繁琐、费时, 容易引起病人间的交叉感染。为此, 我们试制了盐酸达克罗宁口含片, 含服后10min即可进行插镜检查, 经临床试用数百例, 无明显副反应, 口感适宜, 局麻效果良好。

1 仪器与药品

岛津 UV-200型分光光度计(日本), 752 c 紫外-可见分光光度计(上海第三分析仪器厂), ZRS-4型智能溶出仪(天津大学无线电厂), TDP 单冲压片机(上海第一制药机械厂)。

盐酸达克罗宁(上海轻工实验厂), 薄荷醇(南通薄荷厂), 其余辅料均为药用规格。

2 盐酸达克罗宁含片的制备

2.1 处方组成

盐酸达克罗宁15 g, 乳糖280 g, 天冬甜素6 g, 薄荷醇1.2 g, 共制成1000片。

2.2 制备工艺

称取处方量的盐酸达克罗宁、赋形剂等, 分别过80目筛, 按等量递增法混匀, 以5%PVP 醇溶液为粘合剂, 制成软材, 挤压过筛制粒, 置60℃烘箱内干燥, 取出整粒, 喷洒10%薄荷醇乙醇溶液数毫

升, 置容器内密封贮存数小时, 压片前加入0.5%硬脂酸镁混匀, 压片即得外观光洁的含片。

3 盐酸达克罗宁含片的含量测定

3.1 最大吸收波长的确定

配制 0.1 mg/ml 的盐酸达克罗宁水溶液 500 ml, 精确吸取 5.0 ml 置 50 ml 容量瓶中, 加水至刻度, 摇匀, 在 UV-200 型分光光度计上绘制吸收光谱, 发现其最大吸收波长为 282 nm。

3.2 片剂辅料对含量测定干扰的考察

精密称取含片赋形剂、添加剂适量(约相当于 3 片用量), 置 500 ml 量瓶中, 加水至刻度, 摇匀, 过滤, 吸取续滤液 5.0 ml 加水至 50 ml, 在 UV-200 型分光光度计上绘制吸收光谱, 结果含片辅料在 282 nm 处无吸收, 说明辅料对药物含量测定无干扰。

3.3 标准曲线的绘制

精密称取经 105℃干燥至恒重的盐酸达克罗宁 50 mg 置 500 ml 量瓶中, 加水至刻度, 摇匀, 分别吸取该溶液 2.0、3.0、4.0、5.0、6.0、7.0、8.0 ml 置 50 ml 量瓶中, 加水至刻度, 摇匀, 于波长 282 nm 处测定其吸收度 A, 以 A 值为纵坐标, 浓度为横坐标得标准曲线回归方程 $A = 0.05173C - 0.0019$, $r = 0.9998$ 。

1 本课题为 1995 年广东医学院科研基金资助课题 编号 9508

3.4 回收率试验

按处方分别精密称取药物及辅料(均为3片用量),制备模拟片粉,常规操作测定吸收度,以标准曲线方程计算药物量,进而求得回收率,结果见表1。

Tab 1 Recovery of dyclonine hydrochloride

Added (mg)	Found (mg)	Recovery (%)	Average recovery (%)	RSD (%)
45.36	44.58	98.28		
45.73	45.50	99.51		
46.15	45.63	98.87	99.2	0.62
45.28	45.07	99.54		
46.57	46.48	99.81		

从回收率试验结果可知,本试验主药回收率良好,并且RSD不大,说明该方法测定盐酸达克罗宁含片中药物含量可行。

3.5 样品含量测定

取样品10片,精密称定,研细,精密称取适量(约盐酸达克罗宁30 mg)置250 ml容量瓶中,加水至刻度使之溶解,摇匀,过滤,精密吸取续滤液5.0 ml于50 ml容量瓶中,加水至刻度,摇匀,于282 nm处测定吸收度A值,计算,即得样品含量,含量测定结果见表2。

结果表明,含片中盐酸达克罗宁含量在90.0~110.0%范围之内。

4 溶出度试验

以500 ml蒸馏水为溶剂,水温 $37 \pm 0.5^\circ\text{C}$,转速100 r/min,经2、4、6、8、10 min时,分别取样5.0 ml,并补加等量蒸馏水,样品经过滤,取续滤液于282 nm处测定其吸收度,以含片全部溶

从上述溶出度测定结果可以看出,盐酸达克罗宁含片6 min以前的百分累积溶出较快,差异较大,8 min后的溶出结果较稳定,差异较小,可溶出标示量的95%以上。

5 临床效果

盐酸达克罗宁含片经广东医学院附属医院临床

Tab 2 Content of dyclonine hydrochloride in sample

No.	Content(%)	RSD(%)
961115	100.31	1.41
961118	99.25	0.85
961119	99.07	1.08
961121	100.22	1.26
961125	98.85	1.40

出时的溶液浓度为100%,计算各时间点的相对累积溶出量,结果见表3。

Tab 3 Dissolution results of dyclonine hydrochloride tablets (n=5)

	Time (min)				
	2	4	6	8	10
Dissolution amount ($\bar{x}\%$)	28.8	52.6	85.5	95.5	99.3
$\pm S$	5.3	5.8	6.4	2.9	1.5

应用数百例病人,与该院原内窥镜检查用盐酸利多卡因喷雾剂比较有以下优点:服用方便;可避免交叉感染;无过敏现象;口感适宜;局麻效果显著。

6 讨论

6.1 回收率试验表明,用紫外分光光度法测定盐酸达克罗宁含片的含量,辅料对其无干扰,适用于制剂的质量控制,方法简便、准确。

6.2 由于在含片中添加了具有促透作用的薄荷醇^[2],使得盐酸达克罗宁的表面麻醉效果增强,且口感甘甜、清凉,病人易于接受。

6.3 盐酸达克罗宁含片在体内释出迅速,8 min时累积释放百分率可达95%以上,具有快速、强效的特点。

参 考 文 献

- 1 王连贵,袁勤保. 1%达克罗宁内窥镜检查前表面麻醉评价. 内镜, 1987; 4(3): 10
- 2 王雨人, 黄为民. 薄荷醇增强达克罗宁表面麻醉作用的实验研究. 天津药学, 1995; 7(1): 13

收稿日期: 1997-04-21

Studies on Troche Dyclonine Hydrochloride

Zhu Jianping, Chen Huaping, Zhu Ying et al

(Dept. of Pharmacology, Guangdong Medical College, Zhanjiang 524023)

Abstract Troche dyclonine hydrochloride were studied. A ultraviolet spectrophotometric method for the determination of troche dyclonine hydrochloride has been developed. The UV detector (282 nm) response was linear over a range of 4.0 to 16.0 ug/ml. The method is free of interference from troche vehicle. The average recoveries of dyclonine hydrochloride is $99.20 \pm 0.62\%$.

Key words dyclonine hydrochloride, troche, determination