

讲 座

第四讲 改进的中药剂型及制备

中国中医研究院骨研所 单文铎

中药的传统剂型虽历史悠久，疗效卓著，但随着社会生产力的不断提高，病患者对中药剂型也不断提出更高的要求，因此，在广大科研人员的努力下，在中药剂型的制备中，贯彻古为今用，洋为中用的方针，吸取了现代药剂学的知识和技术，不断实践，推陈出新，涌现出许多中药改进剂型，为临床用药提供了多种给药途径，取得了较大的进展。兹择其与骨伤科相关，且易于制备的剂型，介绍如下。

一、浸出制剂

浸出制剂系指采用适当的溶媒与方法，取药材或饮片，经浸提得到的提取液或经浓缩制成膏状、干膏状的一类制剂。

浸出制剂的特点：①能保持原药材各种成分的综合疗效，故符合中医药理论；②因经去粗取精的过程，故与原药材相比可减少服用剂量；③部分浸出制剂如浸膏、流浸膏等常作为胶囊剂、片剂、冲剂、浓缩丸剂、软膏剂等的原料。缺点为：①部分浸出制剂不适于贮存，久贮后易污染细菌、霉菌等，如汤剂、糖浆剂；②部分制剂(如酒剂、酊剂、流浸膏剂)具有流动性，久贮后虽不易染菌发霉，但运输携带不便等等。

(一) 浸出制剂的有关要求：

1. 溶媒

(1) 水：常用溶媒之一。经济易得，极性大而溶解范围广。药材中的生物碱盐类、甙、苦味质、有机酸盐、鞣质、蛋白质、糖、树胶、色素、多糖类以及酶和少量的挥发油都能被水浸出。缺点是浸出范围广而选择性差，易溶出大量无效成分，给制剂带来困难。

(2) 乙醇：常用溶媒。为半极性溶媒。可溶解水溶性的某些成分，如生物碱及盐类、甙、

糖等；又能溶解非极性溶媒所溶解的一些成分，如树脂、挥发油、内酯等。缺点是有药理作用，价格较贵，易燃。

(3) 丙酮、乙醚、氯仿等：为一种良好的溶媒。但易挥发和燃烧，有一定毒性。价昂。

(4) 脂肪油：能溶解挥发油、树脂、醇、酮或醛类等成分，游离生物碱亦可溶解。浸出范围不大，且粘稠度大。常用的有麻油、花生油、豆油及菜子油等。

浸提辅助剂

为了提高浸提效能，增加浸提成分的溶解度，增加制品的稳定性及除去或减少某些杂质的目的，在浸提溶媒中可特加某些物质，称为浸提辅助剂。常用的有：①酸：可有助于提取生物碱和有机酸类成分。常用的有盐酸、硫酸、冰醋酸等；②碱：适用于浸提生物碱与皂甙。但应用不如酸普遍。常用的为氢氧化铵(氨水)等弱碱。

3. 浸提方法与设备

(1) 浸渍法：为简便而最常用的浸出方法。此法可在常温下进行，易较好地保持其澄明度。尤适用于有效成分迁热易挥发和易破坏的药材，但操作时间较长，且往往不易完全浸出有效成分。具体方法已在上一章药酒法中加以介绍。传统的浸渍容器有缸、坛等，并加盖密封。现代浸渍容器多选用不锈钢罐、搪瓷罐等。

(2) 煎煮法：将经过处理的药材，加适量水加热煮沸2—3次，使其有效成分充分煎出。此法简便易行，可煎出大部分有效成分，但煎出液中杂质较多，容易霉变、腐败，一些不耐热及挥发性成分在煎煮过程中易被破坏、挥发而损失。传统的煎煮器有砂锅、铜锅、铜罐等。

大规模生产则多用多能式中药提取罐等。

(3) 渗漉法：此法系往药材粗粉中不断添加浸出溶媒使其渗过药粉，从下端出口流出浸出液的一种浸出方法。渗漉时，溶媒渗入药材的细胞中溶解大量的可溶性物质之后，浓度增高，比重增大而向下移动，上层的浸出溶媒或稀浸液置换其位置，造成良好的浓度差，使扩散较好地自然进行，故提取效果优于浸渍法，提取也较完全，而且省去了分离浸出液的时间和操作。除乳香、松香等非组织药材因遇溶媒而软化成团，会堵塞孔隙使溶媒无法均匀地通过药材，而不宜用渗漉法外，其他药材均可用此法浸出。渗漉法容器质量要求同煎煮法及浸渍法，一般为园柱形或园锥形。也有用陶缸的。

(4) 回流提取法：在应用乙醇等易挥发的有机溶媒进行加热提取有效成分时用此法。

(5) 水蒸气蒸馏法：本法适用于具有挥发性，能随水蒸气蒸馏而不被破坏，与水不发生反应，又难溶或不溶于水的化学成分中提取、分离，如挥发油的提取。其操作方法是药材的粗粉或碎片，浸泡湿润后，直火加热蒸馏或通入水蒸气蒸馏，药材中的挥发性成分随水蒸气蒸馏而带出，经冷凝后收集馏出液，一般需再蒸馏一次，以提高馏出液的纯度或浓度。

4. 精制的方法

(1) 水提醇沉法与醇提水沉法：水提醇沉法是先以水为溶媒浸提中药材中的有效成分，再以乙醇沉淀去除杂质的方法。而醇提水沉法则系用乙醇提取有效成分而用水沉淀除去杂质。基本原理是利用中药中的大多数成分易溶于水而醇中的特性，用水提出后，再将提取液浓缩，加入适量的乙醇或水反复数次沉降，除去其不溶解的物质，最后剩得澄明的液体。

(2) 其他的方法如液-液萃取法，酸碱法，盐析法，透析法，分子筛法，离子交换法等，多为科研和生产中所常用。但一般情况下，多不进行精制，只是将浸提液经过滤、浓缩后，即可应用。

5. 分离的方法与设备

中药材的浸提液，往往是一种固体如药渣、沉淀物、泥沙及其他固体杂质和液体（含可溶性成分的浸出液）的混合物，须进行分离以除去固体物。一般基层单位经常用的滤材有：纱布、麻布、棉布、绸布、帆布、尼龙绸、滤纸、石棉板，以及各种高分子物质制成的多孔性滤膜等。

6. 蒸发与干燥

中药材经过浸提与分离后，常得到大量的浸提液，需通过蒸发与干燥，才能获得缩小体积的浓缩物或固体产物。一般多在常压下进行蒸发，小量可用瓷质蒸发皿，大量用蒸发锅。当浸出液经蒸发除去大量的水分成为浓溶液后，若需制成干浸膏，则必须通过干燥除去剩余的水分。常用的方法为烘箱或烘房。

(二) 常用浸出制剂

1. 片剂：系将药物细粉或提取物与适宜的赋形剂混合，经加工压制而成园形或其他形式的片状分剂量的剂型，供内服和外用。片剂是在丸剂使用基础上发展起来的，它创用于十九世纪40年代，后随着压片机械的出现和不断改进，才得到了迅速的发展。中药片剂的研究和生产仅在50年代才开始，随着中药化学、药理、制剂与临床几方面的综合研究，中药片剂的品种、数量不断增加，工艺技术日益改进，质量逐渐提高。除一般的压制片、糖衣片外，还有微囊片、口含片、外用片等。现片剂已成为品种多，产量大，用途广，使用和贮运方便，质量稳定的剂型之一。片剂在我国以及其他许多国家的药典所收录的制剂中，均占1/3以上，可见应用之广。

片剂的制备比较繁难，需要特定的机器（压片机等），故没有条件和设备的地方，无法试制。

2. 冲剂：系将药材的提取物加适量赋形剂或部分药材细粉制成干燥颗粒状或块状的内服药剂。用时加开水冲服。冲剂是在汤剂和糖

浆剂的基础上发展起来的一种新剂型。冲剂既保持了汤剂作用迅速的特点，又克服了汤剂临时煎煮不便的缺点，且味道可口、体积小，服用、贮藏及运输均较方便。但易吸潮，且含糖量高，成本也较高。制作亦有一定难度，故制备从略。

3. 流浸膏剂与浸膏剂：流浸膏剂系指用适宜的溶媒浸出药材的有效成分后，蒸去部分溶媒，调整浓度至规定标准而制成的液体浸出制剂。除另有规定外，流浸膏剂每1毫升相当于1克标准。若以水为溶媒的流浸膏，应酌加20~50%量的乙醇作防腐剂，以利贮存。流浸膏剂一般多作为配制酊剂、合剂、糖浆剂或其他制剂的原料，少数品种可直接供药用。

浸膏剂系指用适宜的溶媒浸出药材的有效成分后，蒸去全部溶媒，浓缩成稠膏状或块、粉状的浸出制剂。除另有规定外，每1g浸膏剂相当于原药材2—5g。浸膏剂除少数直接用于患者外，一般多作为制备其他制剂的原料。

4. 酊剂：系指药材用不同浓度的药用乙醇，经浸提或溶解药物而制成的澄明液体制剂。多数的酊剂供内服，少数供外用。酊剂的浓度一般随药物的性质或用途而异，用普通药物制成的酊剂浓度为20%(g/ml)，含毒剧药物酊剂的浓度为10%(g/ml)。

5. 胶囊剂 系将药物盛装于空胶囊中制成的制剂。空胶囊分硬胶囊和软胶囊（胶丸）两种。一般均用明胶为主要原料制成。中药胶囊品种甚多，但多为硬胶囊。主要是浸膏粉或提纯物，也有装原药粉者。胶囊剂是一个较老的剂型，近年来，由于发现某些片剂中的药物溶解吸收速率差而影响了疗效，因而又重新受到重视。胶囊剂不仅外观整洁，容易吞服，而且还具有如下的特点：①可以掩盖药物的不适臭味；②崩解释放药物迅速，所以主药极易吸收；③如某些药物需要到肠中呈现药效，可将药物先制成颗粒，然后装入胶囊，可制成肠溶性胶囊，使药物作用缓慢而持久；④凡不易制

成片剂或丸剂的药物可制成胶囊剂。

胶囊剂的制备比较简单。以中药为原料的处方中剂量小的或细料药等，可直接粉碎成细粉，过100~120目筛，混匀后填充；剂量较大者可先将部分粉性药粉碎成细粉，余药经提取浓缩成稠膏后与细粉混匀、干燥、研细、过筛、混匀后填充。如处方组成中尚含有结晶性或提取的纯品药物时，亦应先研成细粉后再与群药细粉混匀后填充入囊。

6. 注射剂 亦称针剂。系指灌封于特别容器中的灭菌的药物溶液、混浊液、乳浊液或粉末。用注射器注入皮内、皮下、肌肉、静脉或穴位等应用的一种剂型。注射剂的特点为：①药效迅速，作用可靠；②适用于不宜口服给药的患者和不宜口服的药物；③可使个别药物发挥定位药效；④可以穴位注射发挥特有的疗效；⑤注射时疼痛和有不适感。

7. 其他剂型 如合剂、糖浆剂及口服安瓿剂等，与骨伤科用药涉及较小，故不予介绍。

二、外用制剂

(一) 软膏剂：中药软膏是指用中药细粉或经溶剂提取后浓缩后的浸膏，加入适量的基质研匀，制成容易涂布于皮肤或粘膜上的一种外用半固体制剂。对皮肤有保护、滑润及局部治疗作用。软膏剂在我国创始很早。在《五十二病方》中，即有多处应用软膏剂的记载。优良的软膏剂应具备以下质量要求：均匀、细腻、软滑、稠度适宜，易涂布，有吸水性，药物的释放、穿透性较好，性稳定，长期贮藏不变质，无刺激性，易于洗除，用于创伤面应无菌等。

1. 软膏的基质：

(1) 酯类：此类基质包括动、植物油及动物蜡等。其共同特点是润滑，无刺激性，对皮肤起保护及软化作用，一般与药物不发生配伍禁忌，不易长菌，但其缺点是释放药物性能较差，油腻性较大，不易洗除。在中药软膏中以麻油、花生油、豚脂、黄蜡应用较广泛。羊毛脂亦常

应用。

(2) 烃类：系石油馏后得到的各种烃的混合物。此类基质的主要优点是价廉且不易酸败。常用的为凡士林，本品无臭、无味、熔点38~60℃。性稳定，不酸败，无刺激，能与多种药物配伍。对溃烂和裂损创面有保护作用，并能促进表皮的形成。但凡士林吸水性差，释放药物的能力弱，又较油腻，不易清洗，故不适用于急性而有多量渗出液的创面。若加入羊毛脂等基质，可使其性能改善。其次，石蜡与液体石蜡也常应用。

(3) 水溶性基质：此类基质系将原料加水溶解或混和而成的稠厚胶状或糊状物。此类基质无油腻，易洗涤，涂后舒适，并能促进药物的渗透和吸收，但有失水干燥或霉坏的缺点。常用的有甘油明胶。由甘油与明胶溶液加热混合制成，一般明胶用量为1~3%，甘油的用量为10~30%。本品温热后易涂布，涂布后能形成一层保护膜，由于本身有弹性故在使用时较舒适。淀粉甘油（含淀粉10g，安息香酸0.2g，甘油70ml，水20ml，加热制备），皂土（加水混和成稠厚糊状物备用）。

2. 软膏剂的制备：

(1) 研和法：凡软膏中含有的基质比较软，在常温下通过研磨能与药物均匀混合时用此法。混入基质中的药物常是不溶于基质的。在小量制备时用软膏板和软膏刀。大量制备时多用电动乳钵或软膏磨。最好将基质温热至软化，以助不溶性粉末的研和操作。

药物为不溶性固体粉末时，应先研成细粉，再加等量基质研均后，再分次加入其余基质研匀。不易研细的粉物，应另加少量与基质能混合的液体研磨成糊状后，再与基质混匀。

药物为流浸膏者，应先加热除去多余的溶媒，使成糖浆状后，再与基质混合。若为浸膏，应先加溶媒研成糊状，再加基质混匀。

若为少量的毒、剧或结晶性药物，应先加少量水溶解后再用羊毛脂或吸收性基质混合，

然后再加其它基质。

(2) 熔和法：凡软膏中含有的基质熔点不相同，在常温下不能均匀混合者用此法。若主药可溶于基质者亦可用此法混入。或将中药材加入基质中加热熬炼，浸提出有效成分，然后将药渣捞出。挥发性中药材或成分遇热易破坏的中药材，应于基质冷至40℃以下时加入。

(3) 乳化法：将油性物质在一起加热熔融，另将水溶性成分溶于水，并加热至与油相温度相近时(约80℃以上)，逐渐加入油相中，边加边搅，待皂化完全后，搅至冷凝。

(二) 橡胶硬膏：系以橡胶为主要基质，与树脂、脂肪或类脂性物质(辅料)和药物混匀后，摊涂于布或其他裱背材料上而制成的一种外用制剂。俗称胶布。橡胶硬膏所含的成分比较稳定，粘着力强，不经预热可直接粘贴于患处，亦不易产生配伍禁忌，对机体无损害，不污染皮肤和衣物，携带和使用方便。

橡胶硬膏的制备比较简单，但需有专门的机器设备。

(三) 涂膜剂：系用含高分子化合物(如聚乙烯醇缩甲乙醛)的有机溶媒溶解药物而制成的外用液体涂剂。用时涂于患处，溶媒挥散后形成薄膜，对患处有保护作用。同时能逐渐释放所含药物起治疗作用。涂膜剂是在硬膏剂和火棉胶剂的基础上发展起来的一种中西结合的新剂型。其薄膜形成材料是聚乙烯醇缩甲乙醛，冲塑剂为邻苯二甲酸丁二酯，乙醇、丙酮的溶剂。制备工艺简单，不用裱背材料，无需特殊的机械设备，且使用方便。

(四) 栓剂：栓剂亦称坐药或塞药，是由药物和基质混合制成，专供纳入肛门、阴道等腔道的一种固体剂型。栓剂是我国古老的剂型之一。不仅可以用于局部治疗，而且所含的药物能通过粘膜表面吸收入血而起全身作用，故近年来发展迅速。栓剂的制备比较简单，惟对基质要求较严。就目前所知，栓剂在骨伤科疾

(下转26页)

内 固 定

张力形钢丝内固定并中药治疗尺骨鹰嘴骨折

山西省闻喜县医院骨科 王天赐

尺骨鹰嘴骨折除小块撕(裂)脱骨折外都涉及关节,故要求复位准确。我院自1985、5、至1988、5、采用张力形钢丝内固定方法加用中药内服、外熏洗,通过7例临床应用,效果满意。报告如下:

一、临床资料:本组7例,男5例,女2例,均为20—55岁的成年人。骨折类型:均为横断或短斜形。受伤机理:一例为刀砍伤,呈开放骨折,另外六例为间接暴力形成。手术时间均为伤后当天和次日。

经一年以上随访的5例,全部愈合,肘关节活动自如,屈曲在130°—150°,过伸5℃左右,旋前70°—80°,旋后70°—80°。平均六至八周达临床愈合。

二、手术方法:显露骨折端同一般尺骨鹰嘴手术,不剥离骨膜。显露骨折端后维持肘关节伸直位,试复满意后用手摇钻将长约12cm长的细克氏针两根平行由鹰嘴的近折端靠尺骨纵轴的前方慢慢送进尺骨远端的骨髓腔内,针距约1cm,针尾留1.5cm。后在距远折断骨折线2-3cm处用3.0的钻头钻孔(打洞)。用20—22号粗不锈钢丝(或银丝)从此孔穿过,环绕在尺骨鹰嘴的两根针尾上,此时将肘关节屈曲90°,将钢线打结打紧,此时将鹰嘴处的两根克氏针尾向上弯曲埋入三头肌腱内,防止环绕

钢丝脱落。冲洗伤口,逐层缝合,术终。

术后用石膏托固定两周(屈肘位),开始锻炼。

三、中药的应用:早期用攻下逐瘀之方:赤芍30g、木通12g、大黄12g(另包后下)、黄芩10g、柴胡12g、桂枝9g、桃仁9g等。中后期服用接骨续损之方加用熏洗,续断20g、骨碎补15g、地黄12g、土鳖15g、杜仲9g、桂枝9g、丹参20g、乳没各10g等,先水煎服2次后用药渣煎水外熏洗。

讨 论

1. 张力形钢丝内固定治疗尺骨鹰嘴骨折,可达准确复位,又因固定牢靠,可早期活动。符合中西医结合治疗骨折动静结合的观点,因而骨折愈合快。

2. 鹰嘴突是肱三头肌的肌止点,治疗的另一个目的是恢复正常的伸肘力。在鹰嘴骨折两侧的三头肌扩张部份和软组织可有不同程度的撕裂,必将影响伸肘力。所以骨折复位后缝合撕裂的软组织,才能恢复正常伸肘力。

3. 根据骨折治疗的三期用药原则,配合中药内服,外熏洗,可以促进骨折的生长接续、修复愈合。

4. 张力钢丝内固定手术简便、材料来源容易,有利于基层医疗单位开展使用。

(上接38页)

病中应用极少。

(五) 洗擦剂:在中药传统剂型中常应用,系以中药饮片为原料,经煎煮提取药汁供外用洗擦的药剂。骨伤科疾病经常应用。

(六) 其他剂型:随着科学技术的不断发展,一些新的技术不断引入制药技术之中,因

此,一些新的制剂不断出现,为临床提供了新的给药途径。如微型胶囊(系将固体或液体药物,利用高分子物质包裹于药物的表面,使成半透明性或密封的微型胶囊)、气雾剂(系将药物和抛射剂同装在耐压容器中,使用时借抛射剂的压力,将内容物喷出的制剂)等,由于制备复杂,不再进行介绍。