

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 200610016617.8

[51] Int. Cl.
A61K 36/254 (2006.01)
A61K 9/19 (2006.01)

[43] 公开日 2006年10月25日

[11] 公开号 CN 1850136A

[22] 申请日 2006.3.3

[21] 申请号 200610016617.8

[71] 申请人 中国科学院长春应用化学研究所

地址 130022 吉林省长春市人民大街 5625 号

[72] 发明人 刘志强 宋凤瑞 刘淑莹 郑 重

[74] 专利代理机构 长春科宇专利代理有限责任公司

代理人 马守忠

权利要求书 1 页 说明书 3 页

[54] 发明名称

注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针的制备方法

[57] 摘要

本发明涉及注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针的制备方法。取刺五加叶总黄酮提取物，以葡萄糖或半乳糖为骨架剂，骨架剂与刺五加叶总黄酮提取物的重量配比为 1 : 1 - 6，也可以不用骨架剂；加注射用水溶解并稀释至刺五加叶总黄酮提取物浓度为 10 - 60mg/ml，过滤，无菌灌装，冻干，其中预冻温度 -20 - 40℃，预冻时间 2 - 5 小时，冻干全程时间 20 - 32 小时，压封，即得本发明的注射用刺五加叶冻干粉针。冻干粉针剂型与目前已有的溶液型注射剂相比，稳定性好。且冻干后的成品呈疏松多孔状，含水量低，加水后可以迅速溶解，分散均匀，便于临床使用；此外，由于采用溶液形式灌装，其产品剂量准确。

1. 注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针的制备方法，其特征在于：取刺五加叶总黄酮提取物，以葡萄糖或半乳糖为骨架剂，骨架剂与刺五加叶总黄酮提取物的重量配比为 1: 1-6，加注射用水溶解并稀释至刺五加叶总黄酮提取物浓度为 10-60mg/ml，过滤，无菌灌装，冻干，其中预冻温度-20— -40℃，预冻时间 2—5 小时，冻干全程时间 20—32 小时，压封，即得刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针。

2. 如权利要求 1 所述的注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针的制备方法，其特征在于：所述的取刺五加叶总黄酮提取物为有效部位，可以不用骨架剂。

注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针的制备方法

技术领域

本发明涉及一种注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针的制备方法

背景技术

宋士岳等[中国专利, 1113785]以刺五加全草为原料, 经水提醇沉提取及大孔树脂柱分离方法得到刺五加全草提取物, 经冷冻干燥制成刺五加冻干粉针。该方法的水提方式与醇提法相比, 对黄酮类化合物的提取率低。吴光彦等[中国专利 CN1565535]以刺五加茎为原料, 经醇乙醇提取及 AB-8 型大孔吸附树脂柱分离得到提取物, 经冷冻干燥得到刺五加注射冻干粉针。上述两个发明中采用的大孔吸附树脂对黄酮类化合物的分离效果不如聚酰胺树脂, 并且由于刺五加的生长周期较长, 长期以全草及茎为原料, 会导致药用资源的匮乏。

发明内容

本发明的目的针对刺五加可再生药用资源的有效利用, 提供注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针的制备方法

本发明方法的步骤和条件如下: 取刺五加叶总黄酮提取物, 以葡萄糖或半乳糖为骨架剂, 骨架剂与刺五加叶总黄酮提取物的重量配比为 1: 1-6, 也可以不用骨架剂; 加注射用水溶解并稀释至刺五加叶总黄酮提取物浓度为 10-60mg/ml, 过滤, 无菌灌装, 冻干, 其中预冻温度-20—-40℃, 预冻时间 2—5 小时, 冻干全程时间 20—32 小时, 压封, 即得本发明的注射用刺五加叶冻干粉针。

利用刺五加叶总黄酮提取物制备治疗脑血管疾病的冻干粉针, 其中, 刺五加叶总黄酮提取物由刺五加叶经乙醇提取, 聚酰胺树脂分离的制备方法得到, 其总黄酮含量高。冻干粉针剂型与目前已有的溶液型注射剂相比, 稳定性好。且冻干后的成品呈稀松多孔状, 含水量低, 加水后可以迅速溶解, 分散均匀, 便于临床使用; 此外, 由于采用溶液形式灌装, 其产品剂量准确。

本发明采用刺五加叶作为原料药材，从中提取总黄酮作为有效部位制成注射用冻干粉针，与目前投入市场的刺五加注射液相比，具有药用资源可持续利用，用量小，质量稳定，质量控制严格等特点。本方经药效学实验证明在抑制大鼠体内血栓形成、抗血小板粘附、聚集及降低全血和血浆粘度、增加脑血流量，降低脑血管阻力等方面有很好的效果。因此具有广阔的应用前景。

具体实施方式

实施例 1:

取刺五加叶总黄酮提取物 50g，以葡萄糖为骨架剂，骨架剂与刺五加叶总黄酮提取物的重量配比为 1:1，加注射用水溶解并稀释至刺五加叶总黄酮提取物浓度为 10mg/ml，过滤，无菌灌装，冻干，其中预冻温度-20℃，预冻时间 5 小时。冻干全程时间 32 小时。压封，即得本发明的注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针。

实施例 2:

取刺五加叶总黄酮提取物 100g，不加骨架剂，加注射用水溶解并稀释至刺五加叶总黄酮提取物浓度为 20mg/ml，过滤，无菌灌装，冻干，其中预冻温度-20℃，预冻时间 4.5 小时。冻干全程时间 30 小时。压封，即得本发明的注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针。

实施例 3:

取刺五加叶总黄酮提取物 50g，以葡萄糖为骨架剂，骨架剂与刺五加叶总黄酮提取物的重量配比为 1:3。加注射用水溶解并稀释至刺五加叶总黄酮提取物浓度为 30mg/ml，过滤，无菌灌装，冻干，其中预冻温度-30℃，预冻时间 3 小时。冻干全程时间 25 小时。压封，即得本发明的注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针。

实施例 4:

取刺五加叶总黄酮提取物 50g，以葡萄糖为骨架剂，骨架剂与刺五加叶总黄酮提取物的重量配比为 1:4。加注射用水溶解并稀释至刺五加叶总黄酮提取物浓度为 40mg/ml，过滤，无菌灌装，冻干，其中预冻温度-35℃，预冻时间 2.5 小时。冻干全程时间 23 小时。压封，即得本发明的注射用刺五加

叶总黄酮提取物冻干粉针。

实施例 5:

取刺五加叶总黄酮提取物 50g，以半乳糖为骨架剂，骨架剂与刺五加叶总黄酮提取物的重量配比为 1: 5。加注射用水溶解并稀释至刺五加叶总黄酮提取物浓度为 50mg/ml，过滤，无菌灌装，冻干，其中预冻温度-40℃，预冻时间 2 小时。冻干全程时间 20 小时。压封，即得本发明的注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针。

实施例 6:

取刺五加叶总黄酮提取物 50g，以半乳糖为骨架剂，骨架剂与刺五加叶总黄酮提取物的重量配比为 1: 6。加注射用水溶解并稀释至刺五加叶总黄酮提取物浓度为 60mg/ml，过滤，无菌灌装，冻干，其中预冻温度-40℃，预冻时间 2 小时。冻干全程时间 20 小时。压封，即得本发明的注射用刺五加叶总黄酮提取物冻干粉针。