

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷
A61K 31/4402
A61K 9/20
A61P 37/08
A61P 17/00
A61P 11/06



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 200410055344.9

[43] 公开日 2005 年 4 月 6 日

[11] 公开号 CN 1602866A

[22] 申请日 2004.8.23
[21] 申请号 200410055344.9
[71] 申请人 南昌弘益科技有限公司
地址 330029 江西省南昌市南昌高新技术产业
业开发区火炬大街 789 号
[72] 发明人 钱 进 许 军 彭 红 李 平
朱 丹 刘孝乐

权利要求书 1 页 说明书 4 页

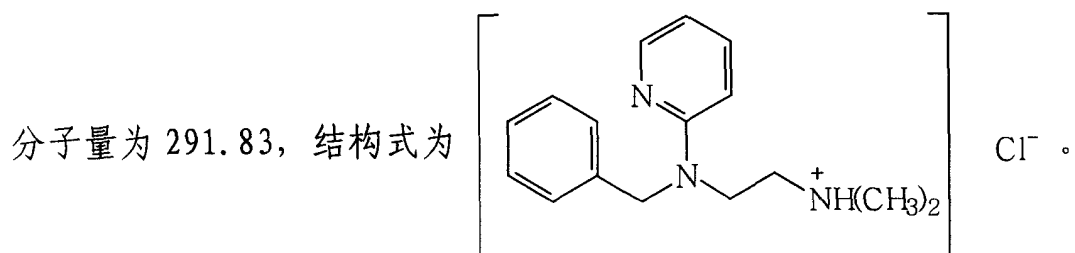
[54] 发明名称 盐酸曲吡那敏滴丸及其制备方法
[57] 摘要

本发明通过应用超微粉碎和滴丸剂生产工艺技术制成的盐酸曲吡那敏滴丸，可以达到提高崩解溶散速度，起效迅速，提高药物稳定性，减少辅料用量，降低生产成本，携带和服用方便的目的。它既可以含服也可以吞服，依从性好，特别适合于儿童、老年人、卧床病人和吞咽困难患者服用。

I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

1. 盐酸曲吡那敏滴丸及其制备方法，其特征在于：将 1 重量份经超微粉碎的盐酸曲吡那敏细粉加入至 1~10 重量份熔融的基质中，充分混匀，滴制法在冷却剂中冷凝成丸，除冷却剂，干燥，即得。

2. 权利要求 1 所述的盐酸曲吡那敏(Tripelennamine Hydrochloride)的化学名称为 N-苄基-N', N' -二甲基-N-吡啶-2-基乙胺，分子式为 $C_{16}H_{21}N_3 \cdot HCl$ ，



3. 权利要求 1 所述的基质包括但不限于聚乙二醇 6000、聚乙二醇 4000、聚乙二醇 1500、聚乙二醇 1000、硬脂酸钠、甘油明胶、泊洛沙姆、硬脂酸、单硬脂酸甘油酸、虫蜡等。

4. 权利要求 1 所述的冷却剂包括但不限于二甲基硅油、液体石蜡、植物油、水、乙醇溶液等。

盐酸曲吡那敏滴丸及其制备方法

技术领域

本发明涉及一种医药配制品及其制备方法，具体地说是盐酸曲吡那敏滴丸及其制备方法。

背景技术

盐酸曲吡那敏为 H_1 受体阻断药，能竞争性阻断 H_1 受体而产生抗组胺作用。抗过敏作用较苯海拉明略强而持久，嗜睡等不良反应较少，镇吐作用也较强而镇静作用弱，并有抗胆碱和局麻作用。

盐酸曲吡那敏在肝脏中代谢，24 小时内用量的 20% 从尿中排出。目前上市销售的仅有片剂，临床用于荨麻疹、枯草热、过敏性鼻炎、湿疹、皮炎、支气管哮喘。

盐酸曲吡那敏在水中极易溶解，但其片剂崩解时间较长，吸收差，生物利用度低，辅料用量比例大，儿童、老年人、卧床病人和吞咽困难患者服用不方便，依从性差，影响了盐酸曲吡那敏治疗作用的发挥。

本发明就是通过应用超微粉碎技术和滴丸制剂工艺技术制成盐酸曲吡那敏滴丸剂，从而克服盐酸曲吡那敏片的以上缺陷，使盐酸曲吡那敏的治疗作用得以充分发挥。

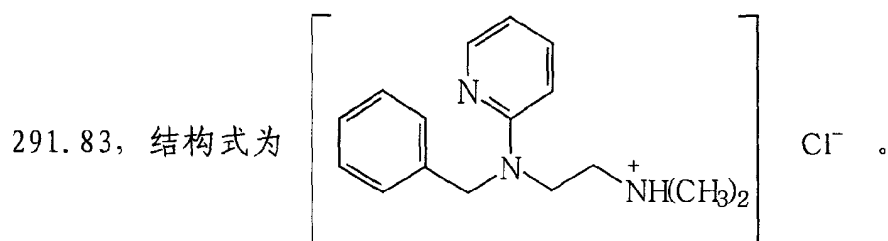
发明内容

通过应用超微粉碎技术和滴丸制剂工艺技术制成的盐酸曲吡那敏滴丸不仅具有崩解溶散快，质量稳定，药丸体积小，既可以吞服也可以含服，携带和服用方便，起效迅速，依从性好，特别适合儿童、老年人、卧床病人和吞咽困难患者服用的特点，而且还具有生产条件和生产设备简单，生产成本低，与片剂相比辅料用量减少的优点，充分体现了新药研究开发以人为本的精神。

为达到上述目的，本发明采用以下技术方案：将 1 重量份经超微粉碎的盐酸曲吡那敏细粉加入至 1~10 重量份熔融的基质中，充分混匀，滴制法在冷却剂中冷凝成丸，除冷却剂，干燥，即得。

本发明中盐酸曲吡那敏(Tripelennamine Hydrochloride)的化学名称为 N-

苄基-N'，N'-二甲基-N-吡啶-2-基乙胺，分子式为 $C_{16}H_{21}N_3 \cdot HCl$ ，分子量为



本发明中的基质包括但不限于聚乙二醇 6000、聚乙二醇 4000、聚乙二醇 1500、聚乙二醇 1000、硬脂酸钠、甘油明胶、泊洛沙姆、硬脂酸、单硬脂酸甘油酸、虫蜡等。

本发明中的冷却剂包括但不限于二甲基硅油、液体石蜡、植物油、水、乙醇溶液等。

下面经过检测对照说明本发明的有益效果

一、检测指标及方法

崩解（溶散）时限：照崩解时限检查法（中国药典 2000 年版二部附录 X A）检查。

二、市售盐酸曲吡那敏片崩解时间检测结果：32 分钟

三、实例 1 样品崩解（溶散）时间检测结果：1 分钟

四、实例 2 样品崩解（溶散）时间检测结果：1 分钟

五、实例 3 样品崩解（溶散）时间检测结果：2 分钟

六、实例 4 样品崩解（溶散）时间检测结果：3 分钟

七、实例 5 样品崩解（溶散）时间检测结果：3 分钟

八、实例 6 样品崩解（溶散）时间检测结果：4 分钟

具体实施方式

一、实例 1

处方：

盐酸曲吡那敏	5g
聚乙二醇 6000	15g
制成	1000 粒

制法：取经超微粉碎过 200 目筛的盐酸曲吡那敏细粉加入至熔融的聚乙二醇 6000 基质中，搅匀，以二甲基硅油为冷却剂，滴制法制丸，干燥，即得。

二、实例 2

处方：

盐酸曲吡那敏	5g
聚乙二醇 4000	15g
<hr/>	
制成	1000 粒

制法：取经超微粉碎过 200 目筛的盐酸曲吡那敏细粉加入至熔融的聚乙二醇 4000 基质中，搅匀，以二甲基硅油为冷却剂，滴制法制丸，干燥，即得。

三、实例 3

处方：

盐酸曲吡那敏	5g
聚乙二醇 6000	5g
聚乙二醇 4000	10g
<hr/>	
制成	1000 粒

制法：取经超微粉碎过 200 目筛的盐酸曲吡那敏细粉加入至熔融的聚乙二醇 4000 和聚乙二醇 6000 混合基质中，搅匀，以二甲基硅油为冷却剂，滴制法制丸，干燥，即得。

四、实例 4

处方：

盐酸曲吡那敏	5g
单硬脂酸甘油酯	15g
<hr/>	
制成	1000 粒

制法：取经超微粉碎过 200 目筛的盐酸曲吡那敏细粉加入至熔融的单硬脂酸甘油酯基质中，混匀，以冰水为冷却剂，滴制法制丸，干燥，即得。

五、实例 5

处方:

盐酸曲吡那敏	5g
聚乙二醇 6000	10g
泊洛沙姆	5g
<hr/>	
制成	1000 粒

制法: 取经超微粉碎过 200 目筛的盐酸曲吡那敏细粉加入至熔融的聚乙二醇 6000 和泊洛沙姆混合基质中, 搅匀, 以二甲基硅油为冷却剂, 滴制法制丸, 干燥, 即得。

六、实例 6

处方:

盐酸曲吡那敏	5g
单硬脂酸甘油酯	15g
泊洛沙姆	1g
<hr/>	
制成	1000 粒

制法: 取盐酸曲吡那敏和泊洛沙姆经超微粉碎过 200 目筛的混合细粉加入至熔融的单硬脂酸甘油酯基质中, 混匀, 以冰水为冷却剂, 滴制法制丸, 干燥, 即得。