

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷
A61K 31/195
A61K 9/14 A61K 9/19
A61P 1/16 A61P 31/12



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 200410024056.7

[43] 公开日 2005 年 1 月 26 日

[11] 公开号 CN 1568956A

[22] 申请日 2004.4.28
[21] 申请号 200410024056.7
[71] 申请人 肖广常
地址 250100 山东省济南市历城区桑园路 50 号
共同申请人 张 颖
[72] 发明人 肖广常 张 颖

权利要求书 1 页 说明书 4 页

[54] 发明名称 一种复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂
[57] 摘要

本发明涉及一种复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，属医药技术领域。 复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂包含以下组分(重量百分比)：二氯醋酸二异丙胺 0.125% ~ 51.29%，葡萄糖酸钠 0.125% ~ 48.71%，赋形剂为 0 ~ 99.75%。 该药在临床上用于肌肉注射或静脉滴注，用于急、慢性肝炎的辅助治疗，也可以用于脂肪肝及其它一切肝脏机能障碍。该药具有质量稳定，临床使用时遇水速溶，更加安全的特点。

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

- 1、本发明为一种复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，其特征在于，包含以下组分，均为重量百分比：二氯醋酸二异丙胺 0.125%~51.29%，葡萄糖酸钠 0.125%~48.71%，赋形剂为 0~99.75%。
- 2、如权利要求 1 所述的一种复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，其特征在于，所述的赋形剂为甘露醇、乳糖、甘氨酸、山梨醇、低分子右旋糖酐、葡萄糖、蔗糖、水解凝胶、环糊精、环糊精衍生物中的一种或几种。
- 3、如权利要求 1 所述的一种复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，其特征在于，所述的复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂可为无菌粉末、无菌冻干品中的一种。

一种复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂

（一）技术领域

本发明涉及一种复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，属于医药技术领域。

（二）背景技术

肝炎病，传染面广，发病高，据统计我国各类肝病患者已有 1.2 亿以上，每个人的生活圈中都有这样的患者。随着生活水平的提高，饮食结构和生活方式都有较大改变，一些"现代病"、"富贵病"发病率越来越高，脂肪肝就是其中最典型的一种。深圳市脂肪肝发病率逐渐上升，脂肪肝已成为威胁市民健康、仅次于病毒性肝炎的第二大肝病。叶红军教授指出，在深圳，超过 10% 的人患有这种疾病，深圳一家医院年度体检脂肪肝检出率甚至高达 39%。特别值得重视的是，由于肥胖儿童的增多，脂肪肝发病呈低龄化趋势，北大深圳医院就曾经收治过一位年仅 14 岁的脂肪肝转肝硬化的小患者。因此，积极治疗各类肝病已越来越被人们所重视。

复方二氯醋酸二异丙胺为二氯醋酸二异丙胺与葡萄糖酸钠组成的复方制剂，系维生素(维肝素)的活性成分，其化学结构上有 4 个甲基，可供机体合成胆碱所需的甲基。胆碱在体内参与脂肪代谢，胆碱是磷脂的组成部分，卵磷脂能与脂肪、胆固醇及蛋白质一起构成脂蛋白而易于溶于血浆，肝内脂肪以脂蛋白的形成运到肝外以减少肝内沉积的脂肪。国内外长期使用证实：该药能明显改善急、慢性肝炎，也可以用于脂肪肝及其它一切肝脏机能障碍。目前复方二氯醋酸二异丙胺上市的制剂为片剂和注射液，然而复方二氯醋酸二异丙胺注射液在制备工艺过程中需经高温灭菌后，易造成分解，使产品质量下降。

（三）发明内容

本发明避免了上述技术的不足，提供了一种复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂。

本发明为一种复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，包含以下组分，均为重量百分比：二氯醋酸二异丙胺 0.125%~51.29%，葡萄糖酸钠 0.125%~48.71%，赋形剂为 0~99.75%。

上述的赋形剂选自甘露醇、乳糖、甘氨酸、山梨醇、低分子右旋糖酐、葡萄糖、蔗糖、水解凝胶、环糊精、环糊精衍生物中的一种或几种。分子量按本领域常规范围即可。

上述的复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂可为无菌粉末、无菌冻干品中的一种。

与现有技术相比，本发明的优良效果如下：

1) 本品选择了粉针剂，整个制备工艺都是在低温或室温的条件下进行，条件温和，无高温灭菌，避免了注射液采用高温灭菌易造成复方二氯醋酸二异丙胺分解，降低了产品质量的现象，使临床应用更加安全。

2) 复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂具有遇水速溶的特点，为临床使用提供了方便。

由上述方法制得的复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，在含量、无菌、pH 等项的检验中均符合有关规定，无毒副作用。本品可用于肌肉注射或静脉滴注，用于治疗急、慢性肝炎，也可以用于脂肪肝及其它一切肝脏机能障碍。

(四) 具体实施方式

实施例 1 复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，组分如下，均为重量百分比：

二氯醋酸二异丙胺	6.93%
葡萄糖酸钠	6.57%
甘露醇	86.50%

制备方法如下：

取二氯醋酸二异丙胺原料 20g，葡萄糖酸钠 19g，加入注射用水 1.5L，搅拌溶解，加甘露醇 250g 搅拌溶解，补加注射用水至 2L，加入针用炭后室温搅拌，过滤脱炭，精滤。滤液按每只 2ml 进行分装，经冷冻干燥即得到复方二氯醋酸二异丙胺无菌冻干品。

实施例 2 复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，组分如下，均为重量百分比：

二氯醋酸二异丙胺	51.29%
葡萄糖酸钠	48.71%

制备方法同 1。

实施例3 复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，组分如下，均为重量百分比：

二氯醋酸二异丙胺	14.39%
葡萄糖酸钠	13.67%
乳糖	71.94%

制备方法如下：

取二氯醋酸二异丙胺原料 40g，葡萄糖酸钠 38g，加入注射用水 3.0L，搅拌溶解，加乳糖 200g 搅拌溶解，补加注射用水至 4L，加入针用炭后室温搅拌，过滤脱炭，精滤。滤液在经喷雾干燥即得复方二氯醋酸二异丙胺无菌粉末。然后按每只 40mg(以二氯醋酸二异丙胺计)进行无菌分装，即得复方二氯醋酸二异丙胺粉针。

实施例4 复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，组分如下，均为重量百分比：

二氯醋酸二异丙胺	1.961%
葡萄糖酸钠	1.862%
葡萄糖	96.177%

制备方法同3。

实施例5 复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，组分如下，均为重量百分比：

二氯醋酸二异丙胺	31.25%
葡萄糖酸钠	29.69%
山梨醇	39.06%

制备方法如下：

取二氯醋酸二异丙胺 80g，葡萄糖酸钠 76g，加入注射用水 1.5L，搅拌溶解，加山梨醇 100g 搅拌溶解，补加注射用水至 2L，加入针用炭后室温搅拌，过滤脱炭，精滤。滤液经真空干燥即得复方二氯醋酸二异丙胺无菌粉末。然后按每只 80mg(以二氯醋酸二异丙胺计)进行无菌分装，即得复方二氯醋酸二异丙胺粉针。

实施例6 复方二氯醋酸二异丙胺粉针剂，组分如下，均为重量百分比：

二氯醋酸二异丙胺	0.500%
----------	--------

葡萄糖酸钠	0.495
-------	-------

葡萄糖	99.005%
-----	---------

制备方法同 5。