

些剂型的制法有可能改变,但从生产或应用角度看,则有其积极意义。例如“浸出制剂”在提取时必须符合浸出原理控制其影响浸出的因素,对所有中药制剂的提取具有指导意义;“干燥制剂”均需浓缩、干燥工序,其蒸发、干燥理论亦具普遍意义;“无菌制剂”不仅是制备工艺严格,而且在贮藏运输,尤其到临床应用要保证无菌,对提高中药制剂的质量有重要意义。

四、按给药途径与方法分类

将采用相同给药途径与用药方法的剂型归列为一类,此种分类方法在临床用药方面具有重要意义。通常将中药剂型分为如下诸类:

1. 经胃肠道给药 口服制剂:此类系在中药剂型中为数最多的,也是最常用的给药方法,以吸收快慢为序有汤剂、合剂、口服液剂、露剂、酒剂与酊剂(内服者)、糖浆剂、滴丸、内服膏剂、散剂、颗粒剂(冲剂)、胶囊剂、片剂、丸剂等;直肠给药:此类剂型的有效成分可不经肝脏首过作用,使药物较直接发挥疗效,如栓剂、灌肠剂等。

2. 不经胃肠道给药 呼吸道给药:如吸入剂、气雾剂、烟剂等;粘膜给药:如滴眼剂、滴鼻剂、含嗽剂、吹入剂、膜剂及含化的片剂或丸剂;皮肤给药:如软膏剂、膏药、橡皮膏、糊剂、搽剂、洗剂、涂膜剂、离子透入剂等;注射给药:均为注射剂,以注射部位分为皮内、皮下、肌肉、穴位、静脉等,注射剂的制备工艺复杂、要求条件高、质量要求最严格、给药操作亦严格,因病证或药料性质的需要制成注射剂,否则不必制为注射剂。

另外,还有按分散系统分类,此法系按药物剂型的物理化学内在分散特性分类,此类在中药制剂中不常应用。

第三节 中药制剂的原辅料

一、中药制剂的原料

中药制剂的原料统称为“中药材”,简称“药材”,包括植物药、动物药、矿物药及其制品。中药制剂的原料是决定制剂质量、疗效、剂型及制备工艺的主要因素,因此,必须高度重视原料。

(一) 药材真伪与制剂疗效的关系

我国药材的种类繁多,古今本草记载的中药约1万种左右,但用于制备中药制剂(中成药)的最常用药只不过数百种。由于这些药材用量大,存在品种混乱问题也较多,虽然部分药材已变野生为家种或家养,品种问题得到一定的保证,但相当一部分药材仍主要依赖天然资源,在挖掘和收购中极易出现混淆,特别是外形相似、同科属不同种植物的药用部分易混入其中,甚至有同科不同属植物的药用部分混用。例如小儿至宝丸、百合固金丸、蛇胆川贝散等中药制剂内的川贝母,来源很复杂,《中华人民共和国药典》记载的川贝母来源有4种,即川贝母、暗紫贝母、甘肃贝母及梭砂贝母,但从市场商品调查来看,来源在20种以上,各批商品常有混杂。各种贝母中不仅总生物碱含量有差异,生物碱的结构也不完全一致,因此,难以保证中药制剂疗效的稳定性,所以在制备中药制剂时,首先必须确定药材品种,以真品投料,才能保证制剂质量与疗效。

(二) 药材品质与制剂疗效的关系

药材品质的优劣与制剂疗效关系密切。药材品质优劣的物质基础是有效成分的含量,而有效成分的含量受药材品种、产地的地理和气候条件、采收加工、炮制等多种因素影响,很难达到一致,因此,对中药制剂质量与疗效造成较大的影响。

药材来源不同有效成分含量不一致。例如黄柏来源于黄檗

树皮和黄皮树树皮,关黄柏(黄檗树皮)的小檗碱含量为0.6%~2.5%;川黄柏(黄皮树树皮)含量为1.4%~5.8%,由不同来源的黄柏制成的中药制剂质量及其疗效,难以一致。

药材的品质与产地关系较大。例如荆芥具有镇痛、抗炎作用,据报道,荆芥的挥发油中薄荷酮具有镇痛作用,胡薄荷酮具有抗炎作用,不同产地的荆芥不仅挥发油含量有差异,且油中两种主成分的含量比也不一致。例如山东全荆芥得油率为0.5077%,其中 α -薄荷酮占45.79%,胡薄荷酮占34.55%;而江都全荆芥得油率为1.1846%,其中 α -薄荷酮占34.27%,胡薄荷酮占42.43%。

药材采收期不当也是影响品质的重要因素。例如防风、桔梗等药材是地下部分入药,一般应在春季刚出苗或秋后霜降前后采挖,此时地下部分饱满,有效成分含量较高,但现在有的在开花期挖掘,且不论植株年龄一齐挖,致使药材瘦瘪,品质下降。

药材的加工炮制过程是否合理对品质有影响。例如药材天麻在采挖后,既要及时杀酶防止有效成分分解,同时又要避免有效成分在水烫等过程中损失。因此,加工过程中的科学检测,确定最佳加工条件,是保证品质与疗效的重要措施。

药材的贮藏保管也是保证药材品质的重要环节。例如珍贵药材番红花,主要成分为番红花甙类,贮藏过程中光线及湿度均能使其成分含量逐渐降低,贮藏多年的番红花其含量可降至极少的程度。

综上所述,药材质量包括真伪和优劣两个方面,真伪是保证品质优劣的前提,而品质优劣则是药材发挥疗效的基础,两者缺一不可。为保证制剂的质量,在目前未形成全国统一标准之前,研究生产一种中药制剂就应该首先确定药材的质量标准,然后制订出制剂的质量标准,以达到保证质量的目的。

(三) 中药材的质地与制剂的关系

制剂制备过程中必须考虑药材的质地。植物药有根、茎、叶、花、果实、种子等,不同的药用部分,药料质地不一样,加工工艺亦不同。药材的质地又与含有成分密切相关。根类药材乌头与附子(块根与子根)质地较坚硬,紫草(根)则比较松软。茎有木质茎与草质茎之分,如沉香质地坚硬而重,灯心草(茎髓)则轻而软。叶类药材按叶具革质,苏叶则松软。花蕾入药,丁香质坚,银花则松软。种子类药材,菟丝子、酸枣仁质地坚硬难以粉碎。核桃仁、黑芝麻含有大量油脂,粉碎过筛均困难,在复方固体制剂中必须采取“串油”处理;含糖质较多的粘性药材熟地、桂圆肉,粉碎极其困难,在复方固体制剂中必须采取“串料”处理。动物药材原料入药部位为皮、肉、骨、筋、甲等,更是质地各异,制剂工艺也截然不同。

制剂制备过程中还须熟悉其所含主要成分和有效成分。主要成分往往是含量多,但不一定是有效成分,如淀粉、糖类、纤维素、油脂及蛋白质等,然而也可能属有效成分(如天花粉中引产成分是蛋白质,巴豆中有效物质为油脂,猪苓多糖具有增强免疫功能作用)。主要成分是决定药材质地的物质基础,根据传统制药经验,药材可分为粉性、粘性、油性、燥性等,均依赖于物质基础而成的质地。这些质地对制剂制备中粉碎、浸提、干燥、成型等均有影响,必须采取针对性措施,才能制成合格的制剂。

药材中的有效成分,含量往往较低,有的是千分之几或万分之几,而且大多为小分子物质,它们属于生物碱、萜类、黄酮类、皂甙类、强心甙类、香豆素与内酯、酚类、氨基酸及其他类等,在熟悉各类有效成分共性基础上,还须掌握各味药料中具体有效成分的个性,即其理化性质与配伍变化等,这是保证中药制剂内在质量的关键。

综上所述,作为中药制剂的主体,即中药材、饮片及提取物(包括有效部位和有效成分)的物态、质地及所含成分的理化性