

衰老⁽²⁾。

3. 花粉^(3,4)、维生素E均有抗衰老、抗皱作用,使皮肤富有光泽,增强弹性。它们已被用作化妆品。

4. 本方中三乙醇胺与部分硬脂酸形成O/W型乳化剂。

5. 尿素能促进皮肤角质水化作用,使皮肤柔软,在本方中有促进药物透皮吸收及止痒⁽⁶⁾的作用。

参 考 文 献

- [1] 高雅琴:老年病新药,月见草及月见草油研究报告(辽宁省药检所资料)1987。
 [2] 索洪勋等:药物制剂信息,1987; 5: 33
 [3] 宫曙光等:药学期报通讯,1987; 6(1): 27
 [4] 张清慎:同上,1988; 6(1): 25
 [5] 沈阳药学院主编:药剂学,第一版,人民卫生出版社1982: 323
 [6] 南京药学院药剂学教研组:药剂学,第二版,人民卫生出版社,1985: 848

退 热 静 栓 剂 的 制 备 及 处 方 注 释

江苏省淮阴市妇幼保健院 周跃民

退热静栓是由异丁苯丙酸为主药制成的肛门栓,主要适用于各种细菌、病毒引起的小儿急性发热以及高热引起的烦躁不安等。经临床使用具有操作方便,起效快,副作用小的优点。

处方组成:

异丁苯丙酸40克

氯丙嗪35克

吐温61适量

月桂酸甘油酯适量

亚硫酸氢钠0.15×10克

焦亚硫酸钠2克

共制成1000粒

处方注解:

1. 异丁苯丙酸为非甾体解热镇痛新药。解热作用优于阿司匹林,副作用较其他解热镇痛药小。将其制成肛门栓剂,直接通过直肠粘膜吸收而进入人体循环,产生全身治疗作用。同时避免首过效应,迅速提高血药浓度。又降低对胃肠道的刺激作用。

2. 氯丙嗪对皮层下中枢包括体温中枢等有广泛的抑制作用,因而使新陈代谢降低,体温下降,使机体处于保护性抑制状

态。同时尚有消除精神兴奋,烦躁不安等作用。

3. 栓剂处方中氯丙嗪与异丁苯丙酸联合应用可发挥协同作用,增强治疗效果。

4. 处方中栓剂基质,开始我们选用较为常用的聚乙二醇类,但因其吸湿性强,受潮后容易变形,特别是在直肠中溶解的液化时间约30—50分钟,从而影响临床退热效果。以后我们筛选出应用吐温类作栓剂基质,其优点是用吐温制成的栓剂无毒性和刺激性,在水中能自行乳化,贮存时亦不起任何理化性质变化,而液化时间只需10分钟以内即完成。

5. 由于栓剂两种主要成份属于酸性和偏酸性,故采用适合在酸性环境作用的亚硫酸氢钠和焦亚硫酸钠作抗氧化剂。以防止主药的氧化,保持栓剂的稳定性。

配制方法

将计算量的基质在水浴上加热熔化混匀,然后再加入亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠、氯丙嗪、异丁苯丙酸,随加随搅拌,趁热倾入栓剂模孔,稍为溢出模口为度。俟完全凝固后用刀切去溢出部分。开启模具将栓剂取

出。每粒含异丁苯丙酸0.04克、氯丙嗪0.035克。

调配注意事项

1. 混合基质时应先将熔点高的熔化, 然后再将熔点低的加入。温度不宜过高以免变质。

2. 药物加入熔融的基质后, 应不断搅拌, 使药物分布均匀, 气体溢出。如果搅拌太快, 则许多小气泡混入液内, 冷后制成的栓剂含量不准, 且外观亦浑浊不清。

3. 一般有2/3量熔融时即停止加热并搅拌, 这样既能使之全部熔化, 又可避免过热。

4. 熔融后的液体应迅速乘热倾入栓剂模型内, 并一次注满。栓剂模型温度最好控

制在50—60℃之间, 倾入后任其自然凝结。不必用冷水或冰水冷却。

5. 成品自模型内取出后, 应立即装入干燥的棕色玻璃瓶内, 以防止空气的氧化作用。

用法与用量

取栓剂直接塞入肛门2厘米, 发热时使用, 如能排便后使用效果更好, 用药后可能有部分药液流出, 擦除即可。

贮存

密封于容器中, 放置凉暗处贮存。

本栓剂处方是根据我院临床药理学实验室所设计的小儿退热栓改良而成, 经临床使用, 疗效确切, 并有起效快, 使用方便之优点。

喷雾干燥法直接制备茶碱—苯巴比妥可压性粉末混合物及复合物

采用喷雾干燥技术因溶剂蒸发迅速, 已广泛用于加工对热敏感的食品、化学品、药品干燥的有效方法。液态微滴经化学反应直接制备固体微粒为近年来新技术之一。苯巴比妥与茶碱合用, 它有抑制茶碱对中枢神经的兴奋作用。喷雾干燥法直接制备可压性茶碱—苯巴比妥固体微粒的混合物, 可避免吸收慢和生物利用度差的缺点。

方法: 用硅胶(0~15g)及甲基纤维素(0~2.0g)作为茶碱(10.5~21g)和苯巴比妥(9~13.5g)的赋形剂, 加水或2.8%氢氧化铵作搅动20分钟使成匀浆, 用3000转/分的离心旋转喷雾器, 以20~33ml/分的速度喷入可调温的干燥器中(保持 $90 \sim 145^{\circ} \pm 5^{\circ} \text{C}$), 成品用气旋收集器收集。

药物含量测定及鉴别: 采用分光光度计于波长280nm处以蒸馏水作溶剂测定茶碱。为消除茶碱的吸收在0.1N氢氧化钠溶液中使用双光束分光光度计, 以256和288.3nm处测定苯巴比妥。茶碱在256和288.3nm波长处其克分子吸收系数均为 5.69×10^3 , 而苯巴比妥在此波长处克分子吸收系数分别为 7.33×10^3 和418。测定苯巴比妥的标准校正曲线方程为: $Y = 0.0305X + 0.0022$

Y : 在256与288.3nm处的吸收差; X : 苯巴比妥的浓度($\mu\text{g}/\text{ml}$)。

用红外分光光度计和X射线分析进行了喷雾干燥成品的鉴别。以扫描差热分析仪作茶碱—苯巴比妥的相图, 测定参比物质中茶碱与苯巴比妥的比例, 以检定产品。将各种不同比例的茶碱—苯巴比妥的混合物置于一烧杯中, 渐热至熔融, 冷至室温, 然后将重新固化的细粉样品以扫描差热分析仪中加热, 加热速度为 $10^{\circ}\text{C}/\text{分}$, 由所取的数据建立茶碱—苯巴比妥相图。用此鉴别产品复合物中茶碱与苯巴比妥的比例。

结论: 用水性匀浆制成的产品主要为茶碱和苯巴比妥的物理混合物, 其中混有少量的分子复合物; 而用氢氧化铵匀浆制得的产品主要为茶碱和苯巴比妥的分子复合物。影响产品中分子复合物数量的参数, 主要是赋形剂(硅胶或甲基纤维素)的量和配方中茶碱与苯巴比妥的组成比例, 喷雾干燥温度也有一定的影响。

[International Journal Of Pharmaceutics 《国际药剂学杂志》, 18:335~343, 1984 (英文)]

徐传福摘译 刘春及校