

药剂学重点总结(九) PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E8_8D_AF_E5_89_82_E5_AD_A6_E9_c23_17515.htm

1) 脂肪酸山梨坦商品名为司盘(Span)，是失水山梨醇脂肪酸酯。分为司盘20、司盘40、司盘60、司盘65、司盘80、司盘85等。其HLB值从1.8~3.8，是常用的W/O型乳化剂。常与吐温配合使用。

2) 聚山梨酯商品名为吐温(Tween)，是聚氧乙烯失水山梨醇脂肪酸酯。其结构与脂肪酸山梨坦比，增加了聚氧乙烯基团，亲水性大大提高，HLB值在8以上，可用作增溶剂、分散剂、润湿剂及O/W型乳化剂。与司盘的命名相对应，有吐温(聚山梨酯) 20、40、60、65、80、85等多种。

3) 聚氧乙烯脂肪酸酯/醇醚 商品名为卖泽(Myrij)/苜泽(Brij)，两类都具有较高的HLB值，亲水性较强，可作为增溶剂及O/W型乳化剂使用。

4) 聚氧乙烯-聚氧丙烯共聚物 又称为泊洛沙姆(Poloxamer)，商品名为普朗尼克(Pluronic)。通式为 $\text{HO}(\text{C}_2\text{H}_4\text{O})_a-(\text{C}_3\text{H}_6\text{O})_b-(\text{C}_2\text{H}_4\text{O})_a\text{H}$ 。相对分子量可在1000~14000。聚氧丙烯基团比例增加，则亲水性增加。

Poloxamer188 (Pluronic F68) 是一种O/W型乳化剂，是目前可用于静脉乳剂的极少数乳化剂之一。

9.2.3表面活性剂的特性【掌】 1 . 形成胶束与增溶作用亲水性较大的表面活性剂以较低的浓度分散在水中可形成真溶液。随其浓度增加，多个表面活性剂分子会缔合形成胶束，能形成胶束的最低浓度即为临界胶束浓度(CMC)。表面活性剂在水中达到CMC后，由真溶液变为胶体溶液，并具有增溶作用。一些水不溶性或微溶性药物会进入胶束的不同位置而使其在水中的溶解度

显著增加，这个过程称为增溶，而表面活性剂则称为增溶剂。

1) 温度对表面活性剂的溶解度的影响 (1) 对离子型表面活性剂温度升高溶解度增加，超过某一温度时溶解度急剧增大，称这一温度为Krafft (克拉费特) 点。Krafft点越高的表面活性剂，其临界胶束浓度越小。Krafft点是表面活性剂应用温度的下限。(2) 对于某些聚氧乙烯型非离子表面活性剂当温度升高到一定程度时，可导致聚氧乙烯链与水之间的氢键断裂，而在水中的溶解度急剧下降并析出，溶液出现混浊，这一现象称为起昙，此温度称为浊点或昙点。吐温类表面活性剂有起昙现象，但泊洛沙姆188等聚氧乙烯类非离子表面活性剂在常压下观察不到浊点。

2. 亲油亲水平衡值表面活性剂分子中亲水基团和亲油基团对油或水的综合亲和力称为亲油亲水平衡值(HLB值)。HLB值越大，表面活性剂的亲水性越强，反之亦然。非离子型表面活性剂混合使用时，其HLB值具有加和性。HLB值不同的表面活性剂，其用途也不同。HLB值为3~6者，适合用作W/O型乳化剂，如司盘类表面活性剂；HLB值为7~9者，可用作润湿剂；HLB值为8~18者，适合用作O/W型乳化剂；HLB值为13~18者，可作增溶剂。

3. 生物学性质

1) 对药物吸收的影响药物如果不在胶束内部或容易从胶束中扩散出来，则表面活性剂的存在一般会促进药物的吸收。

2) 毒性与刺激性是选择时要考虑的重要指标。表面活性剂毒性大小的一般顺序是：阳离子表面活性剂>阴离子表面活性剂>非离子表面活性剂。(1) 阳离子表面活性剂由于毒性较大，只作为消毒杀菌使用。(2) 阴离子表面活性剂有较强的溶血作用和刺激性，也只能用作外用。(3) 非离子型表面活性剂毒性较小，可用作口服。其

中Poloxamer188毒性较低，可供静脉注射用；而吐温80的溶血作用虽然最小，但也只能用于肌肉注射。两性离子型表面活性剂中的卵磷脂是静脉注射剂中最常用的。

9.2.4表面活性剂在药剂学中的应用

表面活性剂的应用常用于油的乳化；难溶药物的增溶；悬浊液的分散与助悬；增加药物的稳定性；促进药物的吸收；固体有润湿、起泡与消泡、去垢等作用。

9.3液体药剂的溶剂和附加剂

9.3.1液体药剂常用的溶剂

1. 极性溶剂
 - 1) 水
 - 2) 甘油
 - 3) 二甲基亚砷 (DMSO)
2. 半极性溶剂
 1. 乙醇
 2. 1, 2-丙二醇
 3. 聚乙二醇 (PEG)
3. 极性溶剂

在水中难溶解或不稳定的药物，可选用非极性溶剂，大多作外用液体制剂的溶剂。常用的有脂肪油（麻油、豆油、花生油等）、液体石蜡、醋酸乙酯等。

9.3.2液体药剂的附加剂

液体药剂的处方组成，除药物与溶剂外，其余均为附加剂，包括：

1. 防腐剂
2. 芳香矫味剂
3. 着色剂
4. 增溶剂
5. 助溶剂
6. 乳化剂
7. 润湿剂
8. 助悬剂
9. 絮凝剂、反絮凝剂
10. 抗氧剂

9.3.3液体药剂的防腐

1. 防腐的重要性
2. 液体药剂的卫生学要求 《中国药典》中关于药品卫生标准中对液体制剂规定：口服药品1g或1ml不得检出大肠杆菌、不得检出活螨；外用药品1g或1ml不得检出绿脓杆菌和金黄色葡萄球菌。还规定了细菌数、霉菌数的限量。
3. 防腐措施
 - 1) 防止污染
 - 2) 添加防腐剂
4. 液体药剂常用的防腐剂
 - 1) 羟苯酯类 对羟基苯甲酸酯类，也称尼泊金类，常用的有尼泊金甲酯、乙酯、丙酯和丁酯。本类防腐剂在酸性溶液中作用较强，对大肠杆菌作用最强。通常是混合使用，效果较好，内服、外用制剂均可选用。表面活性剂能降低本类防腐剂抑菌能力。
 - 2) 苯甲酸与苯甲酸钠 二者可作为内服或外用

制剂的防腐剂用。苯甲酸在水中难溶，在乙醇中易溶，在酸性溶液中抑菌效果较好，最适pH值是4。苯甲酸钠在水中易溶。 3) 山梨酸 在酸性溶液中效果较好。 4) 苯扎溴胺 又称新洁而灭，为阳离子表面活性剂，为外用消毒防腐剂，在酸性和碱性溶液中稳定，耐热压。 5) 醋酸氯乙定 又称醋酸洗必泰。 100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com