

药剂学重点总结(五) 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_17522.htm 第5章 栓剂 重点内容 1

1. 栓剂的概念、特点和质量要求 2. 影响栓剂中药物吸收的因素 次重点内容 栓剂的常用基质、制备方法、置换价、质量评价与包装储存 考点摘要 5.1 概述 5.1.1 栓剂的概念【掌】

药物与适宜基质制成一定形状的供人体腔道给药的固体制剂。

5.1.2 栓剂的分类【掌】 1. 肛门栓（直肠栓）为圆锥形、圆柱形、鱼雷型等。可发挥局部和全身作用。 2. 阴道栓为球形、卵形、鸭嘴形等。主要发挥局部作用。

5.1.3 栓剂的特点

1. 常温下为固体，体温下迅速软化熔融或溶解于分泌液中。

2. 发挥局部作用，如通便、止痛、止痒、抗菌消炎等。 3.

发挥全身作用。 5.1.4 与口服制剂比较，发挥全身作用栓剂的特点【掌】

1. 部分避免首过效应，降低副作用、发挥疗效；

2. 不受胃肠PH或酶的影响； 3. 避免药物对胃肠道的刺激。

4. 对不能吞服药物的病人可使用此类栓剂； 5. 不能口服的药物可制成此类栓剂。

6. 生产率较低，成本比较高。

5.1.5 栓剂的质量要求【掌】 1. 药物与基质混合均匀，外形圆整光滑，无刺激性。

2. 硬度适宜。塞入腔道后应能融化、软化或溶化，释药。

5.1.6 栓剂的治疗作用【掌】 1. 局部作用的栓剂 通常不吸收。如痔疮栓、局麻栓、消毒栓等故应选择融化或溶解、释药速度慢的栓剂基质。

水溶性基质制成的栓剂因腔道中的液体量有限，使其溶解速度受限，释放药物缓慢，较脂肪性基质更有利于发挥局部药效。如甘油明胶基质常用于起局部杀虫、抗菌的阴道栓基质。

2. 全身作用的

栓剂用于全身作用的栓剂主要是肛门栓。(1)药物吸收途径
栓剂直肠给药后的吸收途径：药物通过直肠上静脉 门静脉 肝脏 大循环。 药物通过直肠下静脉和肛门静脉 髂内静脉 下腔大静脉 大循环。 药物通过直肠淋巴系统吸收。 阴道用栓剂给药后，阴道血管与大循环相连，不经肝脏，且吸收速度较快(2)影响直肠吸收的因素 生理因素 1) 用药时不宜塞得太深，距肛门2cm为宜。距肛门口6cm处，易受肝脏首过作用的影响。 2) 在直肠内保留的时间长，吸收完全。 3) 无粪便的存在，有利于药物的扩散及与肠粘膜的接触。 4) 腹泻、肠梗塞以及组织脱水等均能影响药物从直肠部位吸收的速率和程度。 4) 直肠液的PH值为7.4，中性而无缓冲能力，溶解的药物能决定直肠的pH。 药物的理化性质
a脂溶性与解离度：直肠粘膜属类质屏障，对分子型药物有选择通过性。 $pK_a > 4.3$ ， $pK_a < 8.5$ ，药物主要以分子状存在，易吸收。脂溶性大（油-水分配系数大）的药物易于透过。 b 粒度：影响释放、溶解及吸收。混悬型栓剂中，药物粒径小，吸收快。 c溶解度：吸收的限速过程。药物的溶解度小直肠中溶解的少，吸收少。 基质对药物作用的影响 基质的溶解性与药物相反时，利于释放与吸收。 吸收促进剂及表面活性剂的作用 加入适宜的表面活性剂可促进药物的释放与吸收。 吸收促进剂可直接与肠粘膜起作用，改变膜通透性，加快药物的转运过程。 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