

执业药师西药药剂学知识点辅导：注射剂的组成 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__E6_89_A7_E4_B8_9A_E8_8D_AF_E5_c23_17537.htm

注射剂（injection）是指药物与适宜的溶剂或分散介质制成的供注入体内的溶液、乳状液或混悬液及供临用前配制或稀释成溶液或混悬液的粉末或浓溶液的无菌制剂。注射剂作用迅速可靠，不受pH、酶、食物等影响，无首过效应，可发挥全身或局部定位作用，适用于不宜口服药物和不能口服的病人，但注射剂研制和生产过程复杂，安全性及机体适应性差，成本较高。【相关链接】

注射剂的类型 一、注射用原辅料 供注射用的原辅料，必须符合《中国药典》2005年版或国家药品质量标准所规定的各项杂质检查与含量限度。注射用原辅料，大生产前需做小样试制，检验合格后方可使用。 二、注射用溶剂（一）注射用水 注射用水为纯化水经蒸馏所得的水。纯化水再蒸馏的目的是尽量除去细菌内毒素，以确保配制成的注射剂符合药典热原检查的要求。注射用水用于配制注射剂的溶剂或稀释剂及注射用容器的清洗，也可作为配制滴眼剂的溶剂。【相关链接】

纯化水、灭菌注射用水与制药用水 1．注射用水的质量要求 注射用水的质量要求，《中国药典》2005年版有严格规定。除氯化物、硫酸盐、硝酸盐、亚硝酸盐、钙盐、二氧化碳、易氧化物、不挥发物和重金属按蒸馏水检查应符合规定外，pH值要求5.0～7.0，氨含量不超过0.00002%，细菌内毒素应小于0.25EU/ml。 2．注射用水的制备方法 蒸馏法是制备注射用水最可靠最经典的方法。药典要求供蒸馏法制备注射用水的水源应为纯化水，故原水需经过滤、除离子等过程

纯化后方可使用。注射用水的制备工艺流程: (1) 原水处理。原水通常为经过预处理的自来水, 其质量应符合国家关于生活饮用水的卫生标准。原水中含有悬浮微粒、可溶性无机盐、有机物、微生物、热原及挥发性气体等杂质, 必须经处理成为纯化水后方可作为蒸馏法制备注射用水的水源。原水处理方法有离子交换法、电渗析法和反渗透法。离子交换法 离子交换法处理原水是通过离子交换树脂进行的。最常用的离子交换树脂是732苯乙烯强酸性阳离子交换树脂和717苯乙烯强碱性阴离子交换树脂。一般采用阳离子树脂床、阴离子树脂床、混和树脂床串联的组合方式, 在阳离子树脂床后加一脱气塔, 除去水中二氧化碳, 以减轻阴离子树脂的负担。此法所得水化学纯度高, 比电阻可达100万 $\Omega \cdot \text{cm}$ 以上, 设备简单, 节约燃料和冷却水, 成本低; 离子交换一段时间后树脂老化, 出水质量不合格, 可用酸碱液将树脂再生后继续使用。电渗析法 电渗析法是依据离子在电场作用下定向迁移和交换膜的选择透过性而除去离子的。此法不需消耗离子交换树脂再生所用的酸和碱, 较离子交换法经济, 但制得的水纯度较低, 比电阻一般为5万~10万 $\Omega \cdot \text{cm}$; 反渗透法 在U形管内设置一个半透膜, 半透膜两侧分别放入盐溶液和纯水, 纯水一侧的水分子通过半透膜向盐溶液一侧转移, 使盐溶液液面升高, 此为渗透过程 (osmosis)。两侧液柱的高度差形成的压力即为此盐溶液具有的渗透压。若在盐溶液上施加一个大于该盐溶液渗透压的压力, 则盐溶液中的水分子向纯水一侧渗透, 达到盐、水分离, 此为反渗透 (reverse osmosis)。反渗透法纯化原水一般选用的半透膜膜材为醋酸纤维膜和聚酰胺膜。(2) 蒸馏。小量生产一般用塔式蒸馏水器,

主要包括蒸发锅、隔沫装置和冷凝器三部分。大量生产时，常用多效蒸馏水器或气压式蒸馏水器。制备注射用水的蒸馏水器，应安装有效的隔沫装置，以确保不带入热原。（3）注射用水的收集与贮存。弃去初馏液，检查合格后采用带有无菌过滤装置的密闭收集系统收集，在80℃以上保温、65℃以上保温循环或4℃以下无菌状态下贮存，并于制备12h内使用。

（二）注射用油 注射用油的质量要求应符合《中国药典》2005年版有关规定，应无异臭、无酸败味，色泽不得深于黄色6号标准比色液，10℃时应保持澄明。常用的为注射用大豆油，其酸值不大于0.1，碘值为126~140，皂化值为188~195，相对密度为0.916~0.922，折光率为1.472~1.476。也可用芝麻油、茶油等。【相关链接】酸值、碘值、皂化值

（三）其他注射用溶剂 对需要增加溶解度或提高稳定性的药物，采取复合溶剂，改变溶剂性质是解决问题的方法之一，常用的有以下几种：1. 亲水性非水溶剂 常用的有乙醇、甘油、1,2-丙二醇、聚乙二醇300（PEG300）、聚乙二醇400（PEG400）等。2. 亲油性非水溶剂 常用的有苯甲酸苄酯、油酸乙酯和肉豆蔻酸异丙酯等。以上各种非水溶剂均应符合注射用或药用规格，不能用化学试剂代替。

三、注射用附加剂 注射剂中除药物和溶剂外添加的其他物质统称为附加剂。加入附加剂的主要目的是：增加药物的溶解度；增加药物的物理和化学稳定性；提高使用的安全性，减轻注射时的疼痛；抑制微生物生长。常用附加剂及选用原则是：

（一）抗氧化剂 抗氧化剂为延缓或防止药物氧化的附加剂，用于易氧化药物的注射剂。金属离子可催化药物的氧化反应，故常加入金属螯合剂与由原辅料、溶剂及容器带入注射液的微

量金属离子形成螯合物，消除其对药物稳定性的不良影响。制剂中通入惰性气体也可避免药物氧化。（二）抑菌剂 抑菌剂的作用是杀灭注射剂中活的微生物或抑制其生长繁殖，提高制剂稳定性，用于多剂量装的注射剂及不经灭菌的无菌制剂。静脉和脊椎注射的产品不得加抑菌剂，一次用量超过5ml的注射液应慎加。常用抑菌剂如下。（三）局部止痛剂 肌肉和皮下注射时，对易产生疼痛的制剂，可加局部止痛剂，常用的有苯甲醇（1%~2%）、三氯叔丁醇（0.3%~0.5%）及局麻药盐酸普鲁卡因（1%）、利多卡因（0.5%~1%）等。（四）pH调节剂 pH调节剂用于调节注射剂的pH值，可以提高机体的适应性、增加药物溶解度及提高药物稳定性。常用的pH调节剂(见教材表5‑3)。（五）等渗调节剂 等渗调节剂用来调节注射剂的渗透压与血浆等渗，以防止溶血及减小对机体的刺激性。常用等渗调节剂有氯化钠、葡萄糖。设计输液处方时，若为低渗溶液必须加入渗透压调节剂调节为等渗或等张溶液。等渗溶液系指与血浆渗透压相等的溶液，等张溶液系指与红细胞膜张力相等的溶液。【相关链接】低渗溶液、高渗溶液和不等张溶液（六）其它附加剂 制备注射剂的药物性质和注射剂类型不同，为便于制剂制备和使用、保证药物和制剂的稳定性、延长和提高药效，有些注射剂需要加入其他类型的附加剂，如混悬型注射剂加入润湿剂和助悬剂、乳剂型注射剂加入乳化剂、粉针剂中加入填充剂和保护剂等。此类附加剂包括增溶剂、润湿剂、乳化剂、助溶剂、稳定剂、填充剂（冷冻干燥制品中）、保护剂（蛋白类药物中）等。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