

执业药师西药药剂学知识点辅导：栓剂的组成 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_17620.htm

栓剂系指药物与适宜基质制成供腔道给药的固体制剂。栓剂因施用腔道的不同，分为直肠栓、阴道栓和尿道栓。栓剂由药物与基质组成。除另有规定外，供制栓剂用的固体药物，应预先用适宜方法制成细粉，并全部通过六号筛。根据施用腔道和使用目的的不同，制成各种适宜的形状。

一、栓剂的作用特点 栓剂按其作用范围可分为局部作用栓和全身作用栓，前者是在腔道内起润滑、收敛、抗菌消炎、杀虫、止痒和局麻等局部作用；后者是由腔道吸收入血液起镇静、镇痛、兴奋、扩张血管和抗菌消炎等全身作用。与常规口服制剂相比，全身作用的栓剂有下列优点： 药物不会受胃肠道pH或酶的破坏而失活； 大部分药物可以避免肝首过作用，减少了药物对肝的毒性和副作用； 对胃有刺激的药物可用直肠给药； 适于对不能口服、不愿口服药物或伴有呕吐症状的成人或小儿患者给药。

栓剂最初是以局部作用为目的，但后来发现通过直肠给药可以避免肝首过作用和不受胃肠道的影响，亦适合于对口服用药有困难的患者，故栓剂的全身治疗作用越来越受到重视。栓剂在应用时塞入距肛门口约2cm处为宜，这样有50%~75%的药物可绕过肝脏直接进入体循环。 【拓展提高】栓剂给药后的吸收途径

二、栓剂的基质 基质的质量要求 (一) 油脂性基质 栓剂用油脂性基质时，若药物为水溶性，则释药速度快，对机体作用较快。若药物为脂溶性，则药物须先从油相转入水相体液中，才能发挥作用。转相与药物的油水分配系

数有关。1. 可可豆脂 可可豆脂 (cocoa butter) 是梧桐科植物可可树种仁中得到的一种固体脂肪。主要是含硬脂酸、棕榈酸、油酸、亚油酸和月桂酸的甘油酯。可可豆脂为白色或淡黄色脆性蜡状固体。每100g可可豆脂可吸收20~30g水,若加入5%~10%吐温-61可增加吸水量;且有助于药物混悬在基质中。可可豆脂与疏水材料如胆固醇合用作W/O型基质,与亲水性乳化剂合用作O/W型基质。2. 半合成脂肪酸酯 这类基质化学性质稳定,成型性能良好,具有保湿性和适宜的熔点,不易酸败,目前是取代天然油脂的较理想的栓剂基质。国内已生产的有半合成椰油酯、半合成山苍子油酯、半合成棕榈油酯、硬脂酸丙二醇酯等。【拓展提高】半合成油酯 3. 乌柏脂 4. 香果脂 (二) 水溶性或亲水性基质 1. 甘油明胶 甘油明胶溶解速度与明胶、甘油及水三者组成比例有关,常用比例为水:明胶:甘油=1:2:7,甘油与水的含量越高则越容易溶解,且甘油能防止栓剂干燥变硬。水分含量10%以下,水分过多成品变软。本品多用做阴道栓剂基质,因含有明胶,凡与蛋白质能产生配伍变化的药物,如鞣酸、重金属盐等均不能用甘油明胶作基质。2. 聚乙二醇 PEG4000 和PEG6000的吸湿性很低,但对温度仍很敏感。栓剂在水中的溶解度随液体PEG比例的增多而加速。如PEG 4000中加入PEG 400时,一般含30%PEG 400为最佳。不宜与银盐、鞣酸、奎宁、水杨酸、乙酰水杨酸、苯佐卡因、氯碘喹啉、磺胺类配伍。3. 聚氧乙烯(40)单硬脂酸酯类 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