

中药药剂学辅导：注射剂的附加剂 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__E4_B8_AD_E8_8D_AF_E8_8D_AF_E5_c23_17969.htm 《中国药典》规定，注射剂中除主药外，还可根据制备及医疗的需要添加其他物质，以增加注射剂的有效性、安全性与稳定性，这类物质统称为注射剂的附加剂。选择品种与使用的浓度对机体无毒性，与主要无配伍禁忌，不影响主要的疗效与含量测定。制剂成品说明书中也应注明附加剂的不同用途。

一、增加主药溶解度的附加剂

增加主药溶解度的方法有：采用混合溶剂或非水溶剂。加酸或碱，使难溶性药物生成可溶性盐。在主药的分子结构上引入亲水基团。加入增溶剂，如吐温-80、胆汁等。但使用吐温-80时，可能使含酸性的药物、苯甲醇、三氯叔丁醇等的作用减弱，应予注意。加入助溶剂。常用的有：

- 1、吐温-80：常用的增溶剂，常用量0.5%-1%。主要应用于肌肉注射，有轻微的降压与溶血作用，iv慎用。注意：鞣质或酚性成分，溶液偏酸，加入吐温-80会出现浑浊。含酚性成分，加入吐温-80降低杀菌效果。吐温-80灭菌过程中，会出现浑浊。用法：先将被增溶药物与吐温-80混匀，再溶解。
- 2、胆汁：胆酸类的钠盐，常用量0.5-1.0%。常用的有牛胆汁、猪胆汁、羊胆汁等，有杂质，需要加工处理。注意：药液的PH，PH大于6.9，性质稳定。PH小于6.0，降低增溶效果，影响制剂的澄明度。
- 3、甘油：是鞣质与酚性成分良好的溶剂。用量一般为15%-20%。
- 4、其他：助溶剂如：有机酸及其钠盐、酰胺与胺类。复合溶剂系统。

二、帮助主药混悬或乳化的附加剂

混悬剂、乳化剂（1）助悬剂与乳化

剂应符合下列质量要求： 无抗原性、无毒性、无热原、无刺激性、不溶血； 耐热，在灭菌条件下不失效； 有高度的分散性和稳定性，用少量即可达到目的； 供静脉注射用的助悬剂、乳化剂必须严格控制其粒径大小，一般应小于1 μ m，个别粒径不大于5 μ m。（2）常用的助悬剂：吐温-80、司盘-85、普流罗尼F - 68，羧甲基纤维素、海藻酸钠、聚乙烯吡咯烷酮、明胶、甘露醇、山梨醇、单硬脂酸铝、硅油等。（3）常用的乳化剂：卵磷脂、豆磷脂、普流罗尼F - 68、氧乙烯丙烯聚合物等。

三、防止主药氧化的附加剂目的：为了防止注射剂中由于主药的氧化产生的不稳定现象。防止主药氧化除采用降低温度，避免光照，驱尽氧气，调至稳定性好的pH值及控制微量金属离子等措施外，加入抗氧化剂也起重要作用。（1）常用抗氧化剂及用量：原理：抗氧化剂为一类易氧化的还原剂。焦亚硫酸钠（0.1%~0.2%）、亚硫酸氢钠（0.1%~0.2%）、亚硫酸钠（0.1%~0.2%）、硫代硫酸钠（0.1%）、硫脲（0.05%~0.1%）、抗坏血酸（0.05%~0.2%）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