

中药药剂学：中药制剂的化学变化及防止措施（一）PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/18/2021_2022__E4_B8_AD_E8_8D_AF_E8_8D_AF_E5_c23_18899.htm（一）水解引起的不稳定性

水解反应可分离离子型和分子型两大类。反应过程可用通式表示如下：（1） $R - COO - R + H_2O \rightleftharpoons R - COOH$

+ ROH（2） $R - COO - NHR + H_2O \rightleftharpoons R - COOH + R-NH_2$

（3） $R-X + H_2O \rightleftharpoons R - OH + HX$ （4）甙 + $H_2O \rightleftharpoons$ 甙 + 糖

（5）淀粉 + H_2O 糊精 + H_2O 葡萄糖

1 水解反应实例（1）酯类药物的水解：具有酯键结构的药物一般较易水解，如：亚硝酸乙酯几乎无法制成稳定的液体制剂。

$C_2H_5ONO \rightleftharpoons C_2H_5OH + HNO_2$ 阿斯匹林在湿空气中就可缓缓生成水杨酸和乙酸，故常使阿斯匹林产生醋臭；若为片剂，则崩解性能下降。

（2）酰胺类药物的水解：酰胺类药物一般比酯类药物较不易水解。但有例外如：青霉素G钾盐或钠盐均易水解，由于其分子结构中存在的内酰胺环是四元环，稳定性较差，因此其水溶液贮存7天后，效价可损失78%之多，所以只能制成灭菌粉针剂，临用时配制应用。（3）甙类的水解：

苦杏仁的有效成分为杏仁甙，含量约3%，它是由于苦杏仁甙与龙胆双糖缩合而成，易被共存的苦杏仁酶所水解，进一步分解成氢氰酸和苯甲酸。氢氰酸虽有毒，但极微量的氢氰酸有镇咳作用。因此，苦杏仁需经炮制，以破坏杏仁甙酶，从而保存药材中的苦杏仁甙。

2 延缓药物水解的方法（1）

调pH值：药物一般具有一个最稳定的pH值，只要用适当的缓冲液使药液维持在最稳定的pH值范围内，就能延缓药物的水解。

（2）降低温度：药物的水解反应随温度的升高、反应

加剧，所以降低温度可使水解反应减慢。（3）改变溶剂：在水中不稳定的药物，可采用乙醇、丙二醇、甘油等极性较小的溶剂，能减缓药物的水解。（4）降低药物的溶解度：就难溶药物的饱和溶液而言，药物水解速度与药物溶解度成正比，所以只要降低药物的溶解度，就能延缓水解。（5）制成干燥的固体制剂：水的存在才能发生水解反应，将药物制成粉针剂、干糖浆、颗粒剂等干燥的固体制剂，则不易水解。（6）防潮包装：包装与贮藏过程中，严密防水与防潮，可防止水解。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