

药师指导：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\\_ti2020/183/2021\\_2022\\_\\_E8\\_8D\\_AF\\_E5\\_B8\\_88\\_E6\\_8C\\_87\\_E5\\_c23\\_183036.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/183/2021_2022__E8_8D_AF_E5_B8_88_E6_8C_87_E5_c23_183036.htm) 第5章 栓剂 重点内容

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。 5.2 栓剂基质【熟】 5.2.1对栓剂基质的基本要求 1 . 熔点适宜，即室温时有适宜的硬度与韧性，体温时易软化、熔化或溶解。 2 . 熔点与凝固点之差小。 3 . 安全，对粘膜无刺激性、无毒性、无过敏性。 4 . 稳定，在储藏过程中不发生理化性质的变化，不易生霉。 5.2.2基质的种类

1. 油脂性基质 1) 可可豆脂 同质多晶的组成防过热, 型稳定, 乳剂基质; 2) 香果脂和乌桕脂 3) 半合成脂肪酸甘油酯 4) 合成脂肪酸酯 2. 水溶性基质 1) 甘油明胶 不溶化、缓效、阴道栓基质; 2) 聚乙二醇类 (PEG) 不溶化、缓效、有刺激性; 3. 非离子型表面活性剂类水溶性, 与PEG同; 1) 吐温-61 2) 聚氧乙烯 (40) 单硬脂酸酯类 (Polyoxy 40 stearate) 3) 泊洛沙姆 (Poloxamer) 188型多用, 促吸收, 缓释; 4. 栓孔内涂的润滑剂 1) 脂肪性基质的栓剂, 常用软肥皂、甘油各一份与95%乙醇五份混合所得; 2) 水溶性或亲水性基质的栓剂, 则用油性为润滑剂, 如液状石蜡或植物油等。 3) 可可豆脂或聚乙二醇类, 可不用润滑剂 (不沾模)。

5.3 栓剂的制备【熟】 5.3.1 制备方法 热熔法、冷压法、搓捏法 (隔纸搓捏)。热熔法应用最广。 5.3.2 栓剂药物的加入方法 1、不溶性药物, 应粉碎成细粉, 过六号筛, 再与基质混匀。 2、油溶性药物, 溶解于已熔化的油脂性基质中。基质的熔点或使栓剂过软, 可加适量鲸蜡调节。 3、水溶性药物, 与已熔化的水溶性基质混匀; 或用适量羊毛脂吸收后, 与油脂性基质混匀; 或将提取浓缩液制成干浸膏粉, 直接与已熔化的油脂性基质混匀。 5.3.3 置换价 1. 置换价的概念 药物的重量与同体积基质的重量之比。 2. 置换价 (f) 的计算公式  $f = W/[G - (M - W)]$  G为空白栓的平均重量; W为每粒含药栓的平均含药量; M为含药栓的平均重量。 4) 置换价的意义 根据置换价计算基质的用量。 计算公式  $X = (G - W/f) n$  式中n表示拟制备栓剂的枚数。 5.4 栓剂的质量评价及包装贮存 5.4.1 栓剂的质量检查【熟】 1. 重量差异 2. 融变时限 油脂性基质栓30min内全部融化、软化, 或触压无硬心; 水溶性

基质栓60min内全部溶解。 3. 熔点范围测定 4. 体外溶出速度试验 5. 体内吸收试验 5.4.2栓剂的包装与贮存 原则上每个栓剂都要包装。一般栓剂应贮存于30℃以下密闭贮存 栓剂历年考题 A型题 1. 全身作用的栓剂在直肠中最佳的用药部位在 A. 接近直肠上静脉 B. 应距肛门口2cm处 C. 接近直肠下静脉 D. 接近直肠上、中、下静脉 E. 接近肛门括约肌 (答案B) 2. 不作为栓剂质量检查的项目是 A. 熔点范围测定 B. 融变时异检查 C. 重量差异检查 D. 药物溶出速度与吸收试验 E. 稠度检查 (答案E) 3. 关于可可豆脂的错误表述是 (答案C) A. 可可豆脂具同质多晶性质 B. 晶型最稳定 C. 制备时熔融温度应高于40℃ D. 为公认的优良栓剂基质 E. 不宜与水合氯醛配伍 4. 制备栓剂时, 选用润滑剂的原则是 (答案C) A. 任何基质都可采用水溶性润滑剂 B. 水溶性基质采用水溶性润滑剂 C. 油溶性基质采用水溶性润滑剂, 水溶性基质采用油脂性润滑剂 D. 无需用润滑剂 E. 油脂性基质采用油脂性润滑剂 5. 下列有关置换价的正确表述是 A. 药物的重量与基质重量的比值 B. 药物的体积与基质体积的比值 C. 药物的重量与同体积基质重量的比值 D. 药物的重量与基质体积的比值 E. 药物的体积与基质重量的比值 (答案C) 6. 栓剂中主药的重量与同体积基质重量的比值称 A. 酸价 B. 真密度 C. 分配系数 D. 置换价 E. 粒密度 (答案D) X型题 1. 下列有关栓剂的叙述中, 错误的是 A. 栓剂使用时塞得深, 生物利用度好 B. 局部用药应选择释放慢的基质 C. 置换价是药物重量与同体积的基质重量之比 D. pKa E. 药物不受胃肠PH、酶的影响, 在直肠吸收较口服干扰少 (答案ACD) 2. 增加直肠栓剂发挥全身作用的条件是 A. 粪便的存在有利于药物吸收 B

· 插入肛门2cm处有利于药物吸收 C . 油水分配系数大释放药物快有利于吸收 D . 油性基质的栓剂中加入HLB值大小11的表面活性剂能促使药物从基质向水性介质扩散有利于药物吸收 E . 一般水溶性大的药物有利于药物吸收 (答案BDE) [历年所占分数]0~5分。 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](http://www.100test.com)