

2011年药剂学辅导：表面活性剂增溶作用的应用 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/647/2021_2022_2011_E5_B9_B4_E8_8D_AF_c23_647119.htm

增溶体系是溶剂、增溶剂和增溶质组成的三元体系，三元体系的最佳配比常通过实验制作三元相图来确定！（一）增溶相图 增溶体系是溶剂、增溶剂和增溶质组成的三元体系，三元体系的最佳配比常通过实验制作三元相图来确定。（二）解离性药物的增溶 当解离药物与带有相反电荷的表面活性剂混合时。在不同配比下可能出现增溶、形成可溶性复合物和不溶性复合物等复杂情况。例如在阳离子表面活性剂氯苯甲烃铵水溶液中，阴离子药物的增溶即出现这类现象。一般而言，表面活性剂的烃链越长，即疏水性越强，出现不溶性复合物的可能性越大。解离药物与非离子表面活性剂的配伍很少形成不溶性复合物，但pH值可明显影响药物的增溶量。对于弱酸性药物而言，在偏酸性环境中较大程度的增溶；对于弱碱性药物，则在偏碱性条件下有更多的增溶；作为两性离子则在等电点时有最大增溶量。（三）多组分增溶质的增溶 制剂中存在多种组分时，对主药的增溶效果取决于各组分与表面活性剂的相互作用，例如多种组分与主药竞争同一增溶位置而使增溶量减小；或者，某一组分吸附或结合表面活性剂分子造成对主药的增溶量减小；但某些组分也可扩大胶束体积而增加对主药的增溶等。如苯甲酸可增加羟苯甲酯在聚氧乙烯脂肪醇醚溶液中的溶解。而二氯酚则减少其溶解。（四）抑菌剂的增溶 抑菌剂或其他抗菌药物在表面活性剂溶液中往往被增溶而降低活性，在这种情况下必须增加用量。如果在表面活性剂溶液中的溶

解度越高，要求的抑菌浓度就越大。羟苯丙酯和丁酯的抑菌浓度比甲酯或乙酯低得多，但是，在表面活性剂溶液中，却需要更高的浓度才能达到相同的抑菌效果，因为丙酯和丁酯更容易在胶束中增溶。（五）表面活性剂溶液的化学稳定性

药物增溶后的稳定性可能与胶束表面的性质、结构和胶束缔合体的反应性、药物本身的降解途径、环境的pH值、离子强度等多种因素有关。例如酯类药物在碱性溶液中的水解反应，水解中间产物为带负电荷的阴离子，阳离子表面活性剂的正电荷进行加速反应，阴离子表面活性剂则产生抑制作用。又如，青霉素等β-内酰胺类药物的酸水解被阳离子及非离子表面活性剂抑制而被阴离子表面活性剂催化。而青霉素V在中性溶液中的降解，离子表面活性剂和非离子表面活性剂均无保护作用也无催化作用。表面活性剂尤其是聚氧乙烯类非离子表面活性剂，如果在聚氧乙烯基发生部分水解和自氧化，生成的过氧化物将促使药物氧化降解，例如用聚氧乙烯脂肪醇醚增溶的苯佐卡因极容易氧化变黄。（六）增溶剂加入的顺序

在实际增溶时，增溶剂的增溶能力可因组分的加入顺序不同出现差别。一般认为，将增溶质与增溶剂先行混合要比增溶剂先与水混合的效果好。另外，在增溶药物时，达到增溶平衡时往往需要较长的时间。如果在使用中无需稀释，则用二元相图选择配比比较好。特别推荐：[2011年执业药师考试报名条件](#) [2011年执业药师考试报名时间](#) [2011年执业药师考试大纲](#) 更多信息请访问：[2011执业药师辅导精品班](#) 相关链接：[2011年药剂学辅导：苯妥英钠的药理作用机制](#) [2011年药剂学辅导：苯妥英钠的药物相互作用](#) 欢迎进入 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