

2011年药学专业二复习摘要：注射剂的设计 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_647646.htm 注射剂的设计包括：注射剂处方与工艺设计前的基础工作，注射剂类型、注射途径与剂量的确定，处方与工艺的试验研究，注射剂的安全性和渗透压的调节。

第十节 注射剂的设计

一、注射剂处方与工艺设计前的基础工作

调研内容：

- 1.原料药物的分子结构、相对分子量、是否有结晶水、有无异构化、溶解度与溶解速度、化学稳定性。
- 2.分析方法、分解产物的分析方法。
- 4.体内吸收、分布、消除规律。

二、注射剂类型、注射途径与剂量的确定

对于一般固体药物，首选的是水性溶液型注射剂。难溶性的制成混悬型。半衰期很短的，设计成缓释制剂，也可制成混悬型注射剂，但只能肌肉注射。肌肉注射剂刺激性很大可制成静脉注射剂。也可考虑加入止痛剂制成肌肉注射剂。固体药物很不稳定，不宜制成溶液型，可制成注射用无菌粉末或冻干制品。油类药物在通常注射容量能达到所需药剂剂量时，制成溶液型，否则制成乳剂型。

三、处方与工艺的试验研究

- 1.溶解度的测定与增加溶解度方法
- 2.稳定性的考察与稳定化

20-3

四、注射剂的安全性和渗透压的调节

1.注射剂的安全性

安全性包括毒性、溶血性、过敏性与刺激性。刺激性、疼痛性产生的原因：

- (1)药物本身具有刺激性。
- (2)多数由于pH与渗透压不适引起，渗透压过低可造成溶血。

2.渗透压的调节

人体渗透压与0.9%的生理盐水及5%的葡萄糖溶液等渗，0.9%的生理盐水叫做一个渗透度，浓度为0.45%氯化钠溶液为0.5个渗透度。渗透压的调节方法有：

- (1)冰点降低法：血液与泪液的冰点为-0.52

，凡冰点为-0.52 的药物溶液均为与血液等渗，故可利用冰点降低法来调节药物溶液的等渗。计算公式：

$W = (0.52 - a) / b$ W:每100ml溶液中需加渗透压调节剂的量(g).a：

药物溶液测得的冰点下降度数(0C).b：1%渗透压调节剂的冰

点下降度数(0C)。例：配制100ml2%的盐酸普鲁卡因溶液，

需要加入多少氯化钠，使成等渗溶液。解：盐酸普鲁卡因溶

液浓度为2%时， $a = 0.12 \times 2 = 0.24$ 1%的氯化钠调渗剂的冰点降

低数 $b = 0.58$ 需要加入氯化钠的量 $W = (0.52 - 0.24) / 0.58 = 0.48$

即100ml需要加入0.48g氯化钠,或以0.48%表示。(2)氯化钠等渗

当量法 氯化钠等渗当量法：指与1g药物呈等渗效应的氯化钠

的量 $X = 0.009V - EW$ X：配成体积为V的等渗溶液需加入氯化

钠的量(g) V：欲配药液体积(ml) E：1g药物的氯化钠等渗当

量(查表或给出) W：配制体积为V的药物溶液需加入药物的量

例：已知头孢噻吩钠的氯化钠等渗当量为0.24，欲配制2% 头

孢噻吩钠溶液100 ml，需加入多少氯化钠，使成等渗溶液。

解：V = 100ml.E=0.24.W=2%. $EW = 0.24 \times 2 = 0.48$ $X = 0.009$

$\times 1000.48 = 0.42g$ ，即需加入0.42g氯化钠。(3)等渗溶液与等张

溶液 等渗溶液是指溶液的渗透压与血浆的渗透压相等，等渗

是一个物理概念，等张溶液是指与红细胞膜张力相等的溶液

，在等张溶液中，不会发生溶血现象。等张是个生物学概念

。许多药物溶液的等渗浓度与等张浓度相等或相近，但有些

药物的溶液虽然与血浆等渗，但不等张，故仍有溶血现象。

这类药物一般加入适量的氯化钠或葡萄糖后可避免溶血。3.

注射剂的无痛化 除调解适宜的渗透压外，可加入止痛剂，如

：苯甲醇、利多卡因或0.5%的三氯叔丁醇。在注射剂中具有

局部止痛和抑菌双重作用的附加剂是 A.盐酸普鲁卡因 B.盐酸

利多卡因 C.苯酚 D.苯甲醇 E.硫柳汞 答案：D 更多信息请访问：[#0000ff>执业药师课程免费试听](#) [#0000ff>执业药师互动交流](#) [#0000ff>执业药师在线测试模拟题](#) red>2011年执业药师药专业知识一基础习题汇总 特别推荐：[#0000ff>2011年执业药师考试报名](#)时间 [#0000ff>2011年执业药师考试大纲新变化](#) [#0000ff>2011年执业药师资格考试时间及科目](#) [#0000ff>2011年执业药师考试大纲](#) 相关推荐：[#0000ff>2011年药学专业二复习摘要：输液](#) [#0000ff>2011年药学专业二复习摘要：注射剂的灭菌与无菌技术](#) 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