

出。每粒含异丁苯丙酸0.04克、氯丙嗪0.035克。

调配注意事项

1. 混合基质时应先将熔点高的熔化, 然后再将熔点低的加入。温度不宜过高以免变质。

2. 药物加入熔融的基质后, 应不断搅拌, 使药物分布均匀, 气体溢出。如果搅拌太快, 则许多小气泡混入液内, 冷后制成的栓剂含量不准, 且外观亦浑浊不清。

3. 一般有2/3量熔融时即停止加热并搅拌, 这样既能使之全部熔化, 又可避免过热。

4. 熔融后的液体应迅速乘热倾入栓剂模型内, 并一次注满。栓剂模型温度最好控

制在50—60℃之间, 倾入后任其自然凝结。不必用冷水或冰水冷却。

5. 成品自模型内取出后, 应立即装入干燥的棕色玻璃瓶内, 以防止空气的氧化作用。

用法与用量

取栓剂直接塞入肛门2厘米, 发热时使用, 如能排便后使用效果更好, 用药后可能有部分药液流出, 擦除即可。

贮存

密封于容器中, 放置凉暗处贮存。

本栓剂处方是根据我院临床药理学实验室所设计的小儿退热栓改良而成, 经临床使用, 疗效确切, 并有起效快, 使用方便之优点。

喷雾干燥法直接制备茶碱—苯巴比妥可压性粉末混合物及复合物

采用喷雾干燥技术因溶剂蒸发迅速, 已广泛用于加工对热敏感的食品、化学品、药品干燥的有效方法。液态微滴经化学反应直接制备固体微粒为近年来新技术之一。苯巴比妥与茶碱合用, 它有抑制茶碱对中枢神经的兴奋作用。喷雾干燥法直接制备可压性茶碱—苯巴比妥固体微粒的混合物, 可避免吸收慢和生物利用度差的缺点。

方法: 用硅胶(0~15g)及甲基纤维素(0~2.0g)作为茶碱(10.5~21g)和苯巴比妥(9~13.5g)的赋形剂, 加水或2.8%氢氧化铵作搅动20分钟使成匀浆, 用3000转/分的离心旋转喷雾器, 以20~33ml/分的速度喷入可调温的干燥器中(保持 $90 \sim 145^{\circ} \pm 5^{\circ} \text{C}$), 成品用气旋收集器收集。

药物含量测定及鉴别: 采用分光光度计于波长280nm处以蒸馏水作溶剂测定茶碱。为消除茶碱的吸收在0.1N氢氧化钠溶液中使用双光束分光光度计, 以256和288.3nm处测定苯巴比妥。茶碱在256和288.3nm波长处其克分子吸收系数均为 5.69×10^3 , 而苯巴比妥在此波长处克分子吸收系数分别为 7.33×10^3 和418。测定苯巴比妥的标准校正曲线方程为: $Y = 0.0305X + 0.0022$

Y_2 : 在256与288.3nm处的吸收差; X_2 : 苯巴比妥的浓度($\mu\text{g}/\text{ml}$)。

用红外分光光度计和X射线分析进行了喷雾干燥成品的鉴别。以扫描差热分析仪作茶碱—苯巴比妥的相图, 测定参比物质中茶碱与苯巴比妥的比例, 以检定产品。将各种不同比例的茶碱—苯巴比妥的混合物置于一烧杯中, 渐热至熔融, 冷至室温, 然后将重新固化的细粉样品以扫描差热分析仪中加热, 加热速度为 $10^{\circ}\text{C}/\text{分}$, 由所取的数据建立茶碱—苯巴比妥相图。用此鉴别产品复合物中茶碱与苯巴比妥的比例。

结论: 用水性匀浆制成的产品主要为茶碱和苯巴比妥的物理混合物, 其中混有少量的分子复合物; 而用氢氧化铵匀浆制得的产品主要为茶碱和苯巴比妥的分子复合物。影响产品中分子复合物数量的参数, 主要是赋形剂(硅胶或甲基纤维素)的量和配方中茶碱与苯巴比妥的组成比例, 喷雾干燥温度也有一定的影响。

[International Journal Of Pharmaceutics 《国际药剂学杂志》, 18:335~343, 1984 (英文)]

徐传福摘译 刘春及校