

开 发 苯 佐 卡 因 新 剂 型

上海信谊药厂 倪 宏

苯佐卡因是一种非水溶性的局部麻醉药,很早就在临床上应用,主要用于溃疡、创伤和粘膜表面的麻醉止痛,其软膏还可用作鼻咽导管、内窥镜等润滑止痛^[1]。苯佐卡因作用的特点是:起效迅速,约30秒钟左右

即可产生止痛作用,但维持时间短,约15分钟左右;对粘膜无渗透性,毒性低,不会影响心血管系统和神经系统,这是苯佐卡因优于其它表面麻醉药的突出之点^[2]。(见表1)

表 1

药 物	系 统 吸 收 反 应	起 效 时 间 (分)	持 续 时 间 (分)
Hurricane (含苯佐卡因20%)	无	1/2	15
利多卡因(2%)	有	5	40
地 卡 因(2%)	有	7	135
苯佐卡因(14%)+地卡因(2%)	有	1/2	135

国外使用苯佐卡因的制剂很多,1984年美国药物索引收录苯佐卡因制剂即达104种之多,其中片剂27种,软膏17种,霜剂6种,胶囊剂3种,还有凝胶剂、栓剂、洗剂、气雾剂等。苯佐卡因作用的特点适用于口腔科,如英国ICI的“复方洗必泰片”(Hibitane antiseptic)含盐酸洗必泰5mg,苯佐卡因2mg,治疗口腔和咽喉感染,缓解咽喉痛和喉炎,防止扁桃体切除术和牙科手术后的继发性感染;Armour生产的“AAA”气雾剂,含苯佐卡因1.5%,氯化苄基十六烷基二甲基胺0.0413%,用于治疗由寒冷、滴鼻后和其它刺激所引起的咽喉痛,口腔溃疡及口腔咽喉的轻度感染;美国Beutlich生产的“Hurricane”是以水溶性聚乙二醇为基质,含20%苯佐卡因的软膏,主要用于口腔科注射前局部麻醉和牙结石、牙龈手术前的麻醉止痛,该制剂受到口腔科临床医生和患者的普遍欢迎。

与国外相比,苯佐卡因在我国的使用范围是非常狭窄的,仅仅在一些外用软膏中作为止痒成份,因此它的作用特点没有得到充分的发挥。究其原因,即该药的使用范围受到了药典的限制。中国药典85版223页苯佐卡因(用法与用量)项下明文规定“……限于局部外用”。这一规定,使苯佐卡因除了不能再制成内服药片外,连口腔科的应用范围也受到了禁止。可是比较一下中国药典1985年版和美国药典21版对苯佐卡因质量标准的制订,可以发现两者大部分相同。(见表2)

从上述比较中可以看出,我国药典对苯佐卡因原料的质量控制并不比美国药典低,至于“易炭化物”一项我国药典没有规定,但笔者用我国原料按美国药典规定的方法做过试验,结果完全符合标准。

既然我国药典规定的苯佐卡因原料质量不低于美国第21药典的标准,那末在临床使用上就没有必要限制,可以参照国外标准,

表 2

项 目	中 国 药 典 1985 年 版 (第223页)	美 国 药 典 21 版 (第97页)
含 量	不得少于99.0%	98.0—101.0%
熔 点 范 围	88—91℃	88—92℃熔距不超过 2℃
酸 度	取本品1g,加中性乙醇10ml,溶解后加酚酞指示液2滴与氢氧化钠溶液(0.1mol/L) 0.1ml,应显淡红色。	取本品1g加入[10ml]中性乙醇得澄清溶液,用10ml水稀释,加入2滴酚酞指示液和1滴0.01N氢氧化钠溶液,应显红色。
氯 化 物	取本品0.2g,加乙醇5ml溶解后,加稀硝酸3滴与硝酸银试液3滴,不得立即发生浑浊。	同 左
干 燥 失 重	五氧化二磷干燥器中干燥至恒重,减失重量不得过0.5%。	五氧化二磷干燥3小时,失重不得超过1.0%。
炽 灼 残 渣	不得过0.1%	同 左
重 金 属	不得过百万分之十	0.001%
易 炭 化 物	(无此项检查)	溶解本品500mg于5ml硫酸试液中,其溶液颜色不得深过标准比色液A

使苯佐卡因扩大使用范围,各种剂型相应发展,充分发挥它的临床使用价值。

笔者建议,生产苯佐卡因原料药的厂方,按美国药典标准控制质量,并向当地药政部门申请新的质量标准,标准中不要“限于局部外用”以便制剂厂扩大新的剂型,以适应

临床之需。

参 考 文 献

- [1] Tames E. F. Reynolds: Martindale, 28 Edition, London, 909, 1982
- [2] Katon, R. M.: Digestive Diseases and Sciences, 26(7):52s Supplement 1981