

• 医院药学 •

鼻用前体乳膏的研制

第四军医大学第二附属医院药剂科(西安市, 710038) 尚刚伟 李厚之

提要 本制剂为鼻腔的消炎防腐剂, 主治鼻前庭炎、鼻前庭疖、干燥性鼻炎等。内含23%的硼酸甘油, 通过用吐温-80、司盘-80为混合乳化剂, 得到一稳定性好、稠度适宜、无刺激性及色泽、均匀度都较为理想的前体乳膏。经临床应用, 效果满意。

关键词 硼酸; 硼酸甘油; 吐温-80; 司盘-80; 混合乳化剂; 前体乳膏。

鼻前庭炎、鼻前庭疖及干燥性鼻炎为耳鼻喉科常见的鼻腔疾病。目前^[1], 治疗这些疾病的主要方法是外涂软膏制剂如: 鼻软膏、复方硼酸鼻软膏等。这些软膏的主要成份基本相同主含硼酸, 基质为无水羊毛脂、凡士林、液体石蜡等。其制备过程主要是将硼酸细粉均匀地分散于基质中, 得到一淡黄色的稠状物。治疗效果较为满意, 但稳定性较差, 放置室温一个星期左右便有硼酸结晶及沉淀产生。影响了制剂的均匀度和治疗效果。为了克服制剂的不稳定因素, 提高制剂质量, 同时考虑到鼻腔用药, 应尽量减少软膏对鼻粘膜的刺激性, 特别是这类病员常伴有浅表之糜烂或皲裂、鼻前庭局部充血或见脓点, 对外来刺激较为敏感。我们设计了前体乳膏, 经实验和临床应用, 效果理想。

实 验

一、材 料

原料 硼酸 西安浐河化工厂, 批号 851118, 西安医药公司分装, 批号860530。

仪器 D90-2F型电动搅拌机, 转速 200—6000转/分, 杭州仪表电机厂; 小型三用水厢 北京医疗设备厂。

二、制备工艺

本处方主药为硼酸, 基质为凡士林、无

水羊毛脂、液体石蜡、甘油、吐温-80、司盘-80薄荷油。取硼酸最细粉(6号筛)加入到已加热的甘油中(不超过100℃), 随加随搅拌至完全溶解, 冷至适温时加入吐温-80。另取凡士林、无水羊毛脂、液体石蜡及司盘-80加热熔融后、搅拌均匀, 冷至适温。然后将硼酸甘油逐渐加入到油相中(或将油相加入到硼酸甘油中)搅拌均匀, 冷凝后即得。

三、性状 本品为淡黄色粘稠状软膏剂, 符合《中华人民共和国药典》1990年版, 第二部软膏项下有关的各项规定(附录9页)。本品细腻、有光泽、均匀度好, 有薄荷香气。

四、鉴别 根据《中华人民共和国药典》1990年版, 第二部硼酸盐鉴别试验(附录43页)。1.6 含量测定: 取本品约2g置小烧杯中, 精密称定, 加甘露醇3g与新沸过的冷水20ml置水浴上加热, 振摇使前体乳膏溶解, 放冷至室温, 加酚酞指示液3滴, 用氢氧化钠液(0.1 mol/L)滴定至显微红色, 即得。

每1ml的氢氧化钠液(0.1 mol/L)相当于6.183 mg的 H_3BO_3 。

临 床 效 果

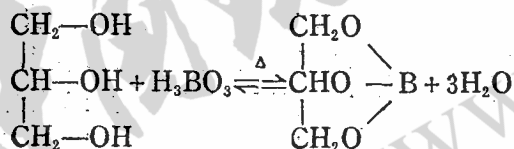
本制剂从1989年12月至今, 经本院耳鼻喉科使用以来反映有以下优点: (1)从外观

上看,稠度、色泽、均匀性都较为满意。(2)稳定性:无结晶、沉淀产生。(3)疗效满意,对鼻前庭炎、鼻前庭疖、干燥性鼻炎显效。特别是对伴有鼻毛脱落、脓痂堆积的病员及需要软化除痂、消炎止痛的效果更佳。(4)刺激性小,且有薄荷香气,病员容易接收。

讨 论

1 硼酸是医院制剂中常用的一种药物,过去所使用的鼻软膏等常不稳定可能是在制剂过程中硼酸只是被均匀地分散于基质中,由于制备时温度控制不当或因未搅拌充分使局部温度过高等,产生了偏硼酸或焦硼酸。故放置一段时间有沉淀产生,同时可能由于上述变化在基质中新生成的水份未完全挥发时或放置一段时间后吸收了空气中的水份,使基质中的硼酸细粉相集结成大结晶随后沉淀。

2 本制剂首先是通过制备硼酸甘油来达到使硼酸完全溶解的目的^[2],其反应式为



反应中有水份产生,可在配制过程中保持适当温度将水除去。未除尽的少量水份可被羊毛脂吸收。另外,本品可进一步制成复方制剂。

3 前体乳膏:或称无水乳膏,是一个W/O型乳膏的中间剂型。通过采用吐温—80^[3],可盘—80为混合乳化剂降低了油相的表面张力,使药物甘油剂与油相充分接触,使得药物分布均匀,成品细腻。其混合乳化剂的使用比例为吐温—80:司盘—80为1:11.5。

4 稳定性实验表明:其稠度、酸碱度、色泽、均匀性及药物含量都无异常改变,并且无霉败现象。

总之,本品是一个外观、稳定性都较为满意,对症显效,刺激性小的理想剂型。目前,它已成为我院耳鼻喉科常用之制剂。

参 考 文 献

- [1] 魏能润主编:耳鼻喉科学,人民卫生出版社,第二版,1985:365
- [2] 尚刚伟等. 硼酸软膏制剂的改进,中国药学会陕西分会第四届药学年会资料集1990:17
- [3] Stoltz, Edwin I: Polysorbate—80 in nasal administration of drugs with nonionic surfactant for reduction of nasal irritation, CA 108, 137901, 1989.

Study on the Preparation of Pro-cream for Nasal

Shang Gangwei LI Houzi

(The Second Affiliated Hospital of The Fourth Military Medical University, Xian 710038)

Abstract

The pro-cream for nasal contained 23% (w/w) boroglycerid and mainly was used to treat nasal vestibulitis, furuncle of nasal vestibule and dry rhinitis. This preparation which had better stability, suitable consistency and without nasal irritator was obtained by the use of both Tween-80 and span-80 as mixed emulsifier. The Clinical observation showed that the effect of the Pro-cream for nasal was quite satisfactory.

Key words Boric acid, Boroglyceride, Tween—80, Span—80, mixed emulsifier, Pro-cream