

甲硝唑剂型的开发和临床应用

丁洁卫, 徐 变(绍兴市人民医院药剂科, 绍兴 312000)

摘要:目的:综述目前甲硝唑多种制剂在临床中的应用。方法:广泛搜集甲硝唑多种制剂和临床应用资料。结果与结论:甲硝唑的不同制剂在临床抗感染方面取得了广泛的应用。

关键词:甲硝唑;制剂;临床应用

中图分类号:R944

文献标识码:A

文章编号:1006-0111(2001)05-0287-02

甲硝唑为人工合成的咪唑类衍生物,对滴虫病、阿米巴病、贾第氏病及厌氧菌引起的感染均有较好的疗效。目前临床上多用甲硝唑片剂和大输液制剂。现又研制出一些新的制剂,并取得了满意的疗效。

1 甲硝唑膜剂

牙周病主要是细菌所致的感染性疾病,其中革兰阴性菌是主要致病菌。甲硝唑能有效抑制革兰阴性菌,是当前治疗牙周病有效的药物。但目前使用甲硝唑片剂治疗牙周病,口服剂量大,药物在牙周局部浓度低。黄武松等^[1]以高分子材料为载体,甲硝唑为主药作成可吸收药膜。处方:甲硝唑 10g,庆大霉素 24 万 u,地塞米松磷酸钠 30mg,甘油 4g,PVA17-88 6g,CMC-Na5g,蒸馏水加至 200ml。此复方牙周膜用来治疗牙周病,总有效率达 96.08%,具有疗程短,不良反应少等优点。夏运岳等^[2]以羧甲基纤维素钠和聚乙烯醇-124 为载体,甲硝唑为主药制成一种可吸收性牙周炎缓释药膜。此膜可贴,口含和插入牙周袋内。此膜具有疗效高,安全无毒,组织相容性好,无刺激性等特点。

2 甲硝唑凝胶剂

复方甲硝唑凝胶是以卡波姆 940 为基质的水溶性透明凝胶,主要成分为甲硝唑和地塞米松钠,可用于治疗口腔溃疡和牙周炎等。处方:甲硝唑 0.5g,地塞米松磷酸钠 0.05g,薄荷脑适量,成纤维细胞生长因子适量,卡波姆 9401.5g,依地酸二钠 0.05g,偏重亚硫酸钠 0.1g,复方尼泊金乙酯醇溶液 1ml,甘油 1ml,乙醇适量,三乙醇胺适量,蒸馏水加至 100g^[3]。另一种甲硝唑凝胶临床上用于厌氧菌、支原体、滴虫或阿米巴原虫引起的感染性阴道炎。处方:甲硝唑 7.5g,羟丙基纤维素 2g,甘油 150g,尼泊金乙酯 0.3g,蒸馏水加至 1000g。58 例患者用此凝胶阴道局部涂药,15d 内治愈率为 87.9%,与口服给药疗效相近,而副作用与复发率较口服为低^[4]。

3 甲硝唑阴道泡腾片^[5]

老年阴道炎是临床常见病和多发病,为了给临床提供更多的治疗手段,制备了复方甲硝唑泡腾片。处方:甲硝唑 200g,己烯雌酚 0.2g,硼酸 60g,淀粉 80g,碳酸氢钠 50g,微晶纤维素 150g,滑石粉 30g 和十二烷基硫酸钠 15g,压制成 1000 片。临床用于老年阴道炎患者 35 例,总有效率 100%,值得临床推广应用。

4 复方甲硝唑软膏剂

根据痤疮的发病机理,曾明辉^[6]等研制出复方甲硝唑霜。处方:甲硝唑 30g,螺内酯 3g,洁霉素 10g,自凡士林 160g,十八醇 90g,液体石蜡 60g,十二烷基硫酸钠 9g,吐温-80 12g,丙二醇 120g,尼泊金乙酯 1g,蒸馏水加至 1000g,用于痤疮,并与口服维生素 B6,外擦硫磺洗剂为对照,总有效率分别为 92.07% 和 70.9%。马文玺^[7]等研制出复方消炎止痛软膏。处方:克林霉素 2.5g,甲硝唑 15g,消炎痛 15g,地卡因 2.5g,薄荷脑 5g,冰片 5g,白凡士林加至 500g。临床用于治疗痔疮手术后局部外敷和痔疮患者。颜会兰^[8]等研制出复方甲硝唑乳膏,临床用于治疗霉菌性阴道炎、滴虫性阴道炎以及顽固性霉菌并滴虫性阴道炎。处方由甲硝唑粉、制霉菌素片、达克宁片、地塞米松粉、升华硫、冰片、非那根、尿素、氟霉素片、单硬脂酸甘油酯、硬脂酸、白凡士林、液体石蜡、甘油、十二烷基硫酸钠、三乙醇胺、尼泊金乙酯组成。

5 甲硝唑灌肠剂^[9]

用羧甲基纤维素为稳定剂,与甲硝唑配制成灌肠剂,可使制剂增稠,延长在肠中停留时间,对肠无毒、无刺激性。该制剂是治疗结肠炎较理想的新剂型,临床应用有效率为 91%。

6 甲硝唑含漱剂

甲硝唑应用于厌氧菌感染,呋喃西林为防腐消毒药,合用制成漱口片,使用方便,疗效确切。处方:

尼古丁缓释片的制备及药剂学研究

顾丽红¹, 陈志东²(1. 上海第二医科大学附属宝钢医院, 上海 201900; 2. 上海市第六人民医院, 上海 200233)

摘要:目的:制备尼古丁缓释片。方法:通过考察了尼古丁缓释片的体外溶出特性,正交设计筛选出最优处方。结果:因素考察研究表明:尼古丁缓释片的释药行为受溶出介质的 pH、压制压力影响不大,转篮转速对溶出速率有一定影响。结论:本方法制备的尼古丁缓释片有一定的缓释效果。

关键词:尼古丁;缓释片;制备

中图分类号:R944.9

文献标识码:A

文章编号:1006-0111(2001)05-0288-02

尼古丁是从烟叶中提取的有效成分,可用于戒烟,尚无片剂及缓释片问世。由此,本文研制了尼古丁缓释片,旨在方便患者用药,减少毒副作用。

1 材料与方

1.1 仪器与材料

羟丙基甲基纤维素(HPMC, Methocel K4M; Colorcon 公司),卡泊姆(Carbopol; B. F. Goodrich 公司),微晶纤维素(Avicel. PH102),磷酸三钙(上海试剂四厂),RCD-6 型药物溶出度测定仪(上海黄海药检仪器厂),78X-2 型片剂四用测定仪(上海

黄海药检仪器厂),751G 型紫外分光光度仪(上海分析仪器厂),TDP 型单冲压片机(中国制药机械厂),pHS-2 型酸度计(上海第二分析仪器厂)。

1.2 方法

将主药与各辅料均过 80 目筛,以 70% 乙醇溶解适量 pvp 作粘合剂,湿法制粒,40℃ 烘干,整粒压片。片剂硬度控制在 5kg/cm² 左右。按中国药典 2000 年版^[1]规定的转篮法进行溶出度试验。

2 结果与讨论

2.1 正交设计

甲硝唑 100g,呋喃西林 50g,蔗糖 300g,薄荷脑 5g,十二烷基硫酸钠 15g,共制成 1000 片,用于治疗咽喉炎,口腔溃疡等疾病。使用时将漱口片一片放入一杯热开水中,溶化放凉后即可漱口^[10]。

7 复方甲硝唑擦剂

根据面部螨虫的生活特点,宁书慧等^[11]筛选最佳处方研制了复方甲硝唑擦剂。处方:甲硝唑 10g,氯霉素 5g,己烯雌酚 0.2g,丙酮 150ml,甘油 100ml,乙基纤维素及聚乙烯吡咯烷酮各 20g,月桂氮草酮 30g,乙醇加至 1000ml。临床治疗酒渣鼻、痤疮,疗效好,未见明显毒副作用。

8 甲硝唑散剂^[12]

复方甲硝唑脐带散处方:甲硝唑 2.5g,氧化锌 10g,硼酸 5g,滑石粉 82.5g,应用此剂敷脐带断经临床 420 例观察,24h 脐带干燥、无出血、无渗出、无脓性分泌物,疗效显著。

甲硝唑具有较强的抗厌氧菌作用,且价格低廉,制成多种剂型可克服口服引起的胃肠道反应,副作用少。如能在控释制剂、靶向给药制剂等方面获得进展,将会大大增加甲硝唑的临床应用。

参考文献:

- [1] 黄武松,凌 俐,刘胜利. 复方甲硝唑牙周膜的制备及质量标准[J]. 中国医院药学杂志,1999,19(2):117.
- [2] 夏运岳,邱 峰,陈幼亭. 甲硝唑牙用缓释药膜的制备及临床应用[J]. 中国医院药学杂志,1996,16(4):165.
- [3] 王增福,朱全刚,王雯信,等. 复方甲硝唑凝胶的研制[J]. 药学实践杂志,1996,14(5):279.
- [4] 杨俊何,杨小平,凌耀生,等. 甲硝唑凝胶的配制与临床观察[J]. 广东药学院学报,1996,12(1):38.
- [5] 孙淑娟,李宏建,牟 燕,等. 复方甲硝唑泡腾片的制备及质量控制[J]. 中国药房,1999,10(3):119.
- [6] 曾明辉,王尚兰. 复方甲硝唑霜的制备及临床应用[J]. 中国医院药学杂志,1996,16(3):132.
- [7] 马文玺,张文志. 复方消炎止痛软膏的制备及临床应用[J]. 中国药房,1999,10(3):117.
- [8] 颜会兰,顾一珠,陈远久. 复方灭滴灵乳膏的研制与疗效评价[J]. 山东医药工业,1998,17(6):3.
- [9] 王芳芳,刘祖雄,杜 蓉. 甲硝唑灌肠液的制备及临床应用[J]. 中国药师,1999,2(3):151.
- [10] 王海龙. 复方甲硝唑漱口片的制备与含量测定[J]. 中国医院药学杂志,1998,18(12):554.
- [11] 宁书慧,常晓村,汤 威,等. 复方甲硝唑涂膜剂的研制与疗效观察[J]. 中国药学杂志,1995,30(增):120.
- [12] 刘 萍,赵翠英,李桂英. 复方甲硝唑脐带散在临床中的应用[J]. 中国医院药学杂志,1996,16(12):572.

收稿日期:2001-02-12