

药 剂 学

中 册

(试用教材)

南 京 药 学 院

一九七四年三月



第六章 注射剂及其它灭菌药剂

第一节 概述

一、注射剂的定义及特点

注射剂 (Injectones) 亦称针剂，系指灌封于特别容器中的灭菌的药物溶液、混悬液、乳浊液或粉末，用注射器注入皮内、皮下、肌肉、静脉、脊椎及穴位等部位应用的一种剂型。

注射剂的特点，主要表现在给药途径不经过消化系统和防御组织（肝、脾）而直接注入组织或血管中，因此药效迅速，适用于急救。但也有些注射剂的功效被延长，以适应医疗上的需要。注射剂的剂量准确，作用可靠，不象内服药物那样可能遭受消化液、食物等的影响，而使服用的剂量不能完全发生疗效。凡不能进行口服给药的患者均可用注射法给药，另外，又可使某些药物发挥定位的作用。如：盐酸普鲁卡因注射液用作局部麻醉，有些药物如胰岛素内服时能被消化道中的酶或酸碱破坏等。

但注射剂也有缺点如：注射时刺激局部而产生疼痛和不舒适；注射液所引起的不良反应快而严重，更难抢救。由于近代医药科学的不断发展，生产技术不断革新，注射剂质量也在不断地提高，所以这些缺点已能逐渐加以克服。

二、注射剂的分类和应用途径

注射剂可分为下列几种：

(一) 液体注射剂 亦称注射液。系将药物配制成溶液（水性或非水性）、混悬液或乳浊液，装入安瓿或多剂量容器中而成的制剂。这主要是根据药物的性质与医疗的要求来决定的。一般水溶性药物要求在注射后达到速效，~~故制成水溶液或水与油的复合溶液~~（如水溶液中另加乙醇、丙二醇、甘油等）。~~对于水溶性药物或~~注射后要求延长其作用者则制成油溶液、水或油的混悬液及乳浊液。

液。但这些注射液一般仅供肌肉注射之用。

(二) 注射用粉剂 亦称粉针。系将供注射用的灭菌粉状药物装入安瓿或其他适宜容器中，临用时用适当的溶剂溶解或混悬的制剂，凡制成溶液后不稳定的药物如青霉素、链霉素、苯巴比妥钠等均可制成注射用灭菌粉末。其它如医药用酶制剂（如胰蛋白酶、 α -糜蛋白酶、菠萝蛋白酶、溶菌酶、双链酶、辅酶A等）为了保持稳定；用冷冻干燥法制成注射用粉针（冻干品）。目前生物制剂的生产方面，采用冻干的方法尤为广泛。

(三) 注射用片剂 系指药物用无菌操作法制成的模印片或机压片，临用时用注射用水溶解，供皮下或肌肉注射之用，如盐酸吗啡注射用片等。

注射剂由于施用途径不同，医疗上常分成：皮下注射剂，剂量多在1~2 ml之间，为无刺激性的水溶液；肌肉注射剂，剂量一般在5 ml以下，可制成水溶液、油溶液、混悬液及乳浊液；静脉注射剂，剂量可多至数千 ml，由于直接与血液接触，故须充分考虑其PH值与渗透压，并不得含有热原、微生物与抑菌剂（除有特殊规定者外）等，脊椎腔注射剂，常用量在10 ml以下，多为水溶液，要求与静脉注射剂相同。

三、注射剂的质量要求

注射剂的工艺过程较复杂，操作要十分精细和准确。车间需十分洁净，以尽量减少微生物的污染。除个别注射剂另有特殊的规定要求外，一般来说必须是主药含量、杂质检查、异物检查、热原试验、无菌试验、毒性试验、PH值以及附加剂的用量和质量等均应符合药典或有关的规定。不符合药典等规定或变质的注射液给人注射后，往往发生不良后果，甚至发生休克或危及生命，或有沾染其他疾病的可能；因此，注射剂不仅在生产时要十分严密和准确，而且要经过严格的检查手续。不合规格者禁止使用。

为了加强生产技术管理，除应有各种生产管理的必要规章制度外，尚应对各个注射剂产品制订工艺规程及有关岗位操作规程。

第二节 注射剂的溶媒

一般制备注射剂用的溶媒有三类，即：(1)注射用水。(2)注射用油：最常用的有麻油、花生油、茶子油等。(3)其他溶媒：如甘油、乙醇、丙二醇、聚乙二醇等。此三类以注射用水和注射用油最为重要。

一、注射用水 (Aqua pro Injectione)

(一) 注射用水的质量要求

注射用水的质量要求在药典中已严格规定，除一般蒸馏水的检查，如酸碱度、氯化物、硫酸盐、钙盐、铵盐、二氧化碳、易氧化物、不挥发物及重金属等均应符合规定外尚须通过热原检查。一般注射剂配制时，多采用质量较高的“新鲜蒸馏水”，因在严格控制条件下，新鲜制得的蒸馏水多能符合注射用水的要求。

(二) 热原

1. 概念与来源 热原系指某些微生物的尸体及其在坛殖时的产物，目前已证实它是一种内毒素。大多数细菌都能在坛殖时产生热原，尤其革兰氏阴性细菌产生热原的作用较革兰氏阳性菌更显著，霉菌与酵母菌类也能产生热原。

污染热原的途径有以下几方面：(1)从溶媒中带入。如注射用水贮存时间过久也会污染热原。(2)从原料中带入。凡贮存年久，如葡萄糖有发霉现象或包装破损的原料最好不用，因其可能导致热原反应；(3)从用具或容器中带入。故用于配制输液的装置、用具、管道以及容器等应加处理，并用无热原的注射用水反复冲洗干净后使用；(4)从制备过程中污染。因此在整个制备过程中，应尽可能减少微生物污染的机会，全部操作过程愈短愈好；(5)从输液器中带入。有时输液本身虽不含热原，但仍发现热原反应。

究其原因，全套输液器（输液瓶、玻璃管、胶皮管、茂斐氏滴管、针头等）的清洁与否，也是能否产生热原反应的关键之一。因此，输液器的处理，不仅要做到化学和物理上的洁净，而且要做到无菌无热原。做好这项工作，亦是杜绝反应的重要途径之一。

注入人体的输液中含有热原的量达 0.001 微克/公斤以上时可致热原反应，常在半小时至1小时内使人体产生发冷，继而颤抖、发热、出汗、昏晕、呕吐等不良反应，有时体温升至 40° 以上，严重者甚至昏迷、虚脱、如不及时抢救，可危及生命安全。

2. 热原的性质 热原的组成极复杂，虽其化学本质至今尚未确定，但其有关性质却比较清楚。

耐热性：热原 60° 加热1小时不受影响，在 120° 加热4小时能破坏98%，在 $180^{\circ} \sim 200^{\circ}$ 加热两小时以上或 250° 加热30分钟可彻底破坏。

滤过性：热原（体积很小，约在 $0.05 \sim 1 \mu$ 之间）与细菌的毒素一样，能通过滤器进入滤液中。但含多层石棉滤板的施氏滤器有吸附热原的作用。

水溶性：热原能溶于水。

不挥发性：热原本身不挥发。

其他：热原能被强酸、强碱所破坏；也能被氧化剂如： KMnO_4 ， H_2O_2 ，或机械力、超声波等所破坏。

3. 热原去除法

(1) 溶液中热原的去除法：根据上述热原的性质，溶液中的热原可用石棉板滤器借吸附作用除去，普通即用施氏滤器，由于石棉滤器有一定的缺点（见石棉板滤器项下），而在注射剂配制中有时不完全适用。生产上采用活性炭吸附的方法，且有脱色助滤的作用，常用量约 $0.1 \sim 0.5\%$ 。

也有人试用分子筛（二乙胺基乙基卜聚矽凝胶）制备无热原

去离子水，初获成功。

(2) 容器中热原的去除法：包括酸碱处理法及干热法两种。热原可被强碱或强酸所破坏。所以清洁容器时应先用清洁液浸洗，或用稀氢氧化钠液煮沸半小时以上都能消灭热原。注射用的针筒，或其他玻璃器皿，在洗涤清洁后烘干，在 250° 加热30分钟以上可破坏其热原。

4. 热原的检查法：常用的热原检查法有下列几种：

(1) 家兔发热试验：为中国药典1963年版法定的方法。系根据供试品注射于家兔后所升高的温度范围而决定热原存在与否。选择健康家兔三只，体重须在 $1.5 \sim 2.5$ Kg 之间（雌兔应无孕），停食至少一小时后，测取肛门正常体温应在 $38.5 \sim 39.6^{\circ}$ 的范围，每隔一小时测一次，共测三次，取末两次平均温度小于 0.2° 者供试用。在测定体温后15分钟内向耳静脉注入温热至 37° 的一定剂量的供试品，注射后每隔一小时测定体温三次，取三次中最高一次减去平均体温，即为该兔的升温数，如其中二只的升温数比兔正常体温高 0.6° 或 0.6° 以上，则判定供试品含有热原。若其中仅一只体温升高 0.6° 或 0.6° 以上，或三只体温升高总达 1.4° ，应另取五只家兔试验，如其中二只或二只以上升高 0.6° 或 0.6° 以上时也认为是阳性。

(2) TBP 反应试验法：由于上述家兔发热试验的动物个体差异很大，操作要求高而且需时长，故曾有研究用TBP试剂以检查热原。TBP即四溴酚酞乙酯，遇微量蛋白质产生变色现象（PH 4.5 黄色，PH 5.5 青色）。但TBP试剂尚与其他化合物，如生物碱、胺的衍生物等均呈阳性反应，同时此法对极微量的热原显色并不敏感，故在实际应用上有一定限制。

(三) 蒸馏法制备注射用水

用蒸馏法制备注射用水所应用的蒸馏设备式样很多，构造各

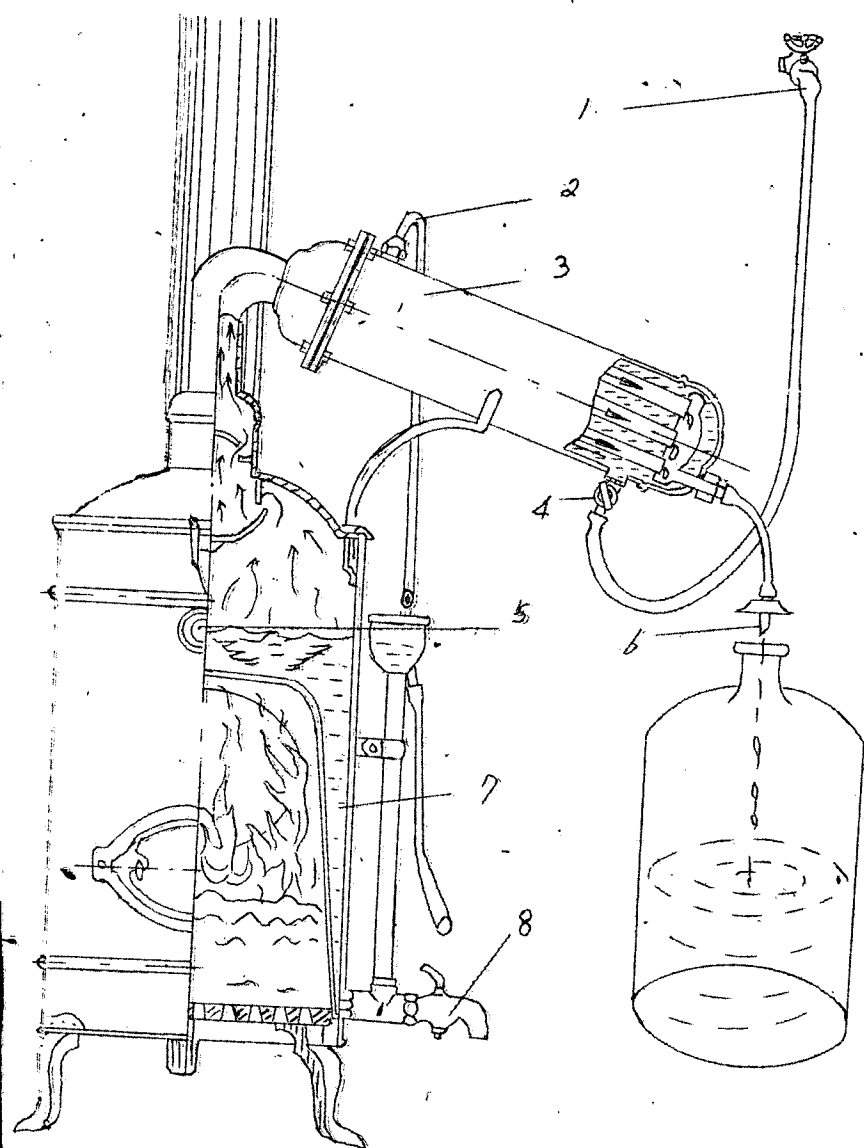


图 6~1 单蒸水器

- | | |
|-----------|----------|
| 1. 水流龙头 | 5. 玻璃水位眼 |
| 2. 回水管 | 6. 蒸馏水嘴 |
| 3. 冷凝冷却器 | 7. 蒸发锅 |
| 4. 进水控制龙头 | 8. 放水龙头 |

并，较普遍应用的有单蒸水器与双蒸水器（亭式、塔式两种）。

1. 蒸水器

(1) 单蒸水器：（见图 6~1）主要由蒸发锅、冷凝器及炉膛三个部分组成。使用时先将放水龙头 8 关闭，开启水龙头 1 使废水从进水控制龙头 4 进入冷凝器 3，再从回水管 2 流入漏斗，然后注入蒸发锅 7 中。直至水位上升到玻璃水位孔眼 5 处停止上升时，可将进水控制龙头 4 暂时关闭。然后开始生火，到锅内的水已经沸腾，并开始出蒸溜水时，再开启进水控制龙头 4。但应注意水流不宜过大过小，一般可用手测试，冷凝器外壳的温度：底部的温度约为 $38\sim 40^{\circ}$ （微温），中部约 $42\sim 45^{\circ}$ （较热），上部约 $50\sim 60^{\circ}$ （烫手）为宜。

本器接烟囱管的高度从烟道口起宜在 3.5 公尺左右。

此种蒸水器共有 5 公升/时、10 公升/时及 20 公升/时三种规格，但蒸溜时实际出水量往往达不到。

水仅作一次蒸溜，往往杂质不能完全除去，在广大基层常出现蒸溜水 PH 值偏低或氨不合格的现象，此种现象均与废水质量有关。如废水中含有二氧化碳而生成的碳酸使水的 PH 值偏低，可在废水中加碱或石灰水调节 PH 至 9 左右，以克服蒸溜水 PH 值偏低；如废水中含有挥发性铵盐使水的 PH 值偏高，可在常水进口处滴加 10~20% 明矾或 1% 硫酸铜溶液，使之与水中挥发性铵盐结合成不挥发性的铵络盐从而得到合格的注射用水，但加碱或加酸性的盐类对蒸溜水器均有一定的侵蚀作用，不宜长期使用，此外可将单蒸水器蒸出的蒸溜水（ 40° 以下的温度）再通过一管离子交换树脂混合床也可改变 PH 值并将氨除去。

(2) 亭式复管蒸水器：（见图 6~2）主要由蒸发锅、冷凝器、盘香型蒸汽加热管三个部分组成。使用时先检查放水龙头 14 是否关妥。本器使用前蒸发锅 12 中必须先加水一次，当锅内的水加至

見自动从水位管8流出时即停止加水。以后的补充水便由锅炉蒸汽水(通过蒸汽管路由回汽管出口3喷出)供給,不需再加。由于蒸发锅的补充水由锅炉蒸汽水供給,所以水流已经一次软化,制出的蒸馏水质量较好,故第一次加入蒸发锅的水最好采用蒸馏水。加水后,每当使用前应先将给汽阀5,回汽阀4均关闭,然后打开放水阀7,使管道中隔夜形成的铁锈水在此放出,避免进入蒸发锅中,影响水质,放完后即行关闭。再将给汽阀5开启,使压力表上升至2 Kg左右;接着将回汽阀4缓缓开启,使压力计1指针慢慢降至0.5 Kg处;约10分钟后再逐渐开大给汽阀和回汽阀,使压力计指针回升到2 Kg左右。回汽温度计2用来观察蒸汽温度,当回汽温度在 $100\sim 120^{\circ}$ 时每小时出水量能达到50升。

(3)塔式蒸馏器:(参6~3)为塔式蒸馏器示意参。

锅炉的蒸汽进口处1经蒸汽选择器2,除去夹带的水珠后,经加热蛇管3放出热量后变成回汽水喷入废气重蒸器4中(装有中性硬质短波管以加大回汽水与空气的接触面积;有利于挥发性气体(CO_2 和 NH_3)跑掉)。回汽水又流入汽锅中,被蛇管加热,产生二次蒸汽,经过隔热装置7上升至第一冷凝器9(U形冷凝器)冷凝成蒸馏水滴于档板上,然后流入第二冷凝器10,进一步冷却后流出,即为二次蒸馏水。

凡奥说明:

1)隔热装置系由档板所组成,中间装有中性硬质短波管,以加大隔热效果。隔热装置滞留下来的水又流回汽锅中;2)在第一冷凝器中不冷凝的气体,可由塔顶排气孔跑掉;3)冷却水先进入第二冷凝器,然后进入第一冷凝器流出;4)塔式蒸馏器在制备蒸馏水前,应由废气重蒸器注入蒸馏水或交换水(如无,可用常水),再开始蒸馏;5)塔式蒸馏器的生产能力,一般有50、100、150、200公升/小时等数种规格。但操作不好,就不一定能达到正

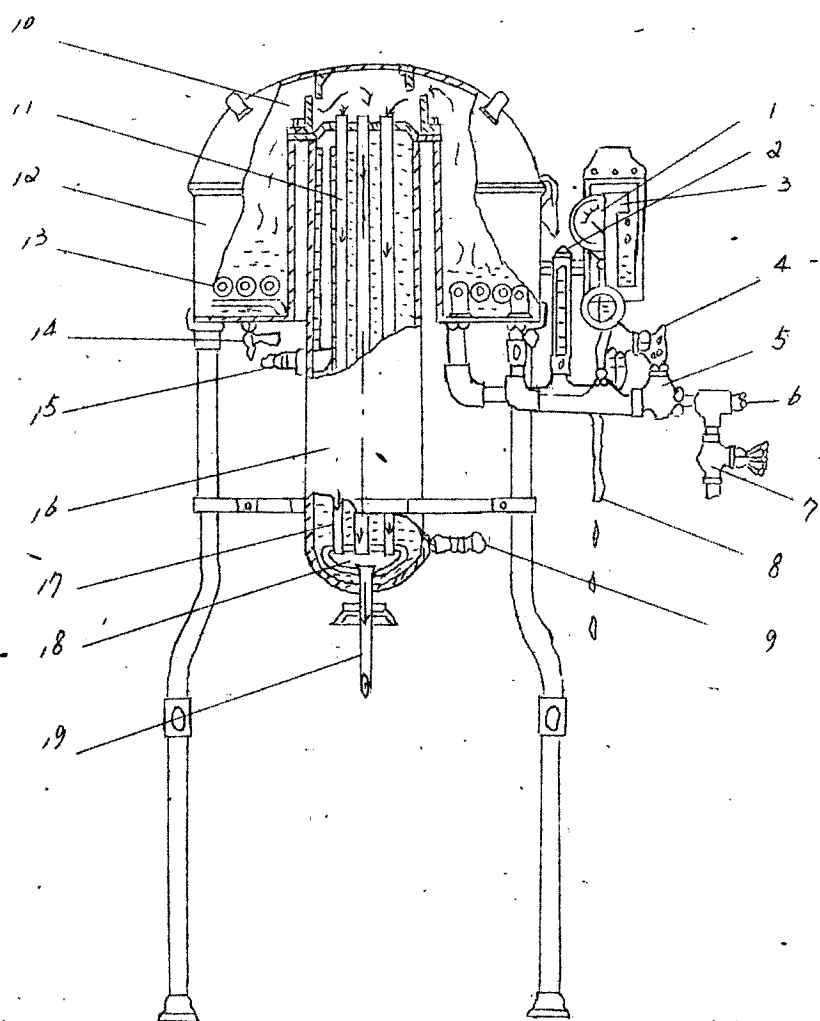


图6~2 索氏萃取器

1. 压力计 2. 温度计 3. 回汽管 4. 回汽阀 5. 给汽阀
 6. 进汽管 7. 放水阀 8. 水位皮管 9. 进水管 10. 挡水帽
 11. 导水管 12. 蒸发锅 13. 盘香形蒸汽加热管 14. 放水龙头
 15. 出水嘴 16. 冷凝器 17. 冷凝管 18. 胖顶 19. 蒸馏水嘴

6 ~ 10

1. 蒸汽进口
2. 蒸汽选择器
3. 蛇管
4. 废汽至蒸发器
5. 中性硬质短玻管
6. 汽锅
7. 隔热装置
8. 挡板
9. 第一冷凝器
10. 第二冷凝器
11. 回汽管
12. 蒸发器进水管
13. 水位管

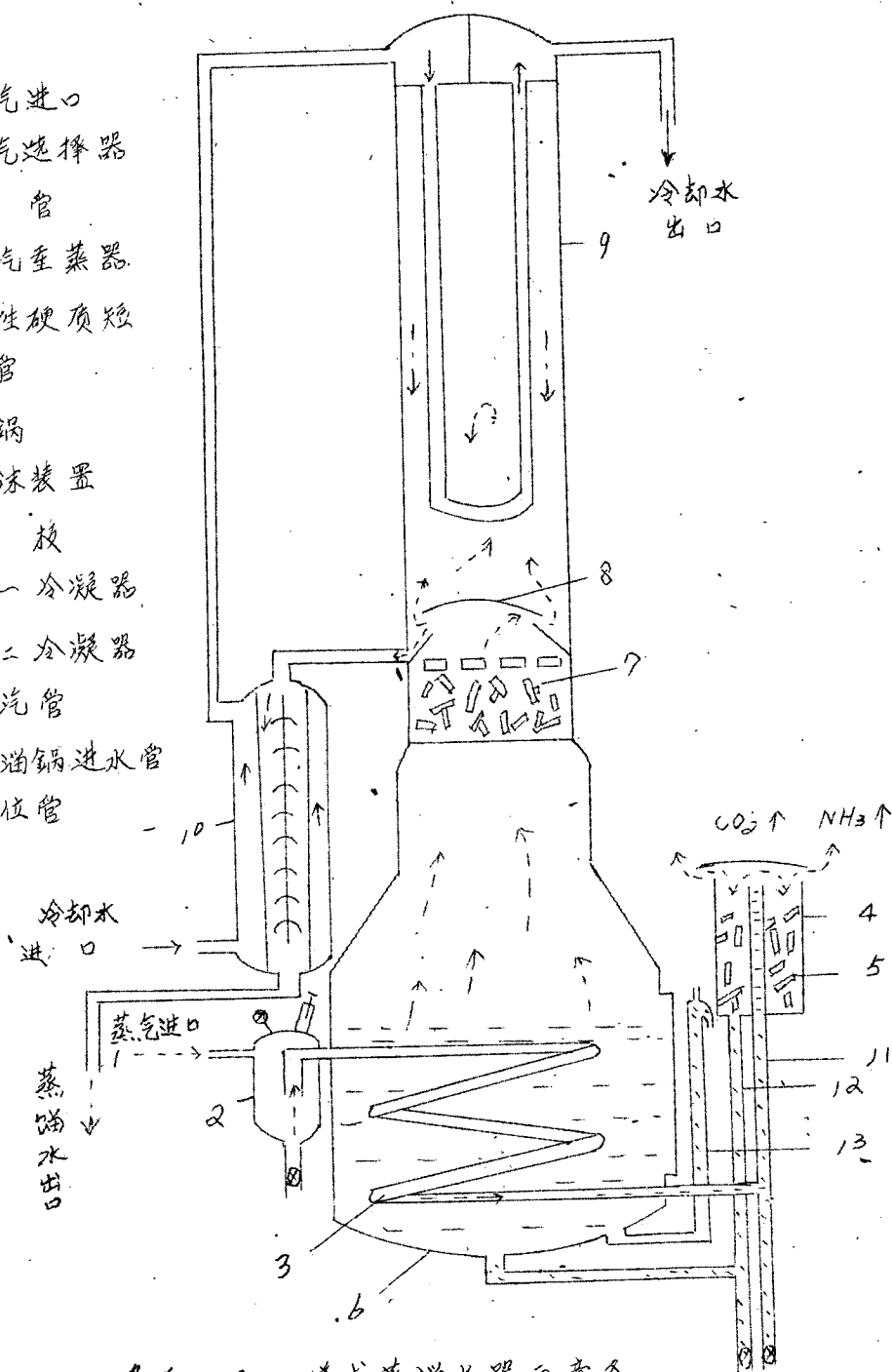


图 6 ~ 3 塔式蒸发器示意图

常的生产能力，主要是控制好蒸汽和冷却水的流量；6) 单蒸馏水若出现 pH 和 NH_3 不合格或不稳定，将加热蛇管出来的单蒸馏水通过阳离子交换树脂，再流回汽锅内，今生产上大都采取此措施。

2. 蒸馏法制备注射用水的要领

用蒸馏法制备注射用水必须注意水流的选择、蒸馏器的构造、操作方法以及制造注射用水场所的清洁卫生等。

一般常水或天然水中含有不挥发性物质与挥发性物质，有无机盐与某些有机物、甚至还含有微生物以及微生物代谢产物等。故水流最好用自来水或经过处理者。

蒸馏器应力求符合下列要求：(1) 一般铜制或用其他金属所制的蒸馏器，内壁与水接触部分须镀纯锡或银。(2) 在蒸汽通路处置几道隔沫板（或称抑留水滴装置），避免水沸腾时雾沫窜入蒸馏水中；(3) 锅内的容器空间不宜过小，即指引至蒸汽进入冷凝器的部分的距离应适当，过短沸腾时所产生的雾沫容易带入冷凝器；过长则导致蒸汽中途冷凝，形成回流现象；(4) 蒸馏器中必须有放气设备。将水中的 CO_2 、 NH_3 等挥发性气体散发；(5) 冷凝器应易于拆洗，有较大的冷凝面积；(6) 冷凝器流出口与接受器之间应有防尘罩，以免空气中尘埃或微生物等进入。

蒸馏器的使用与保养：(1) 蒸馏器应定期拆洗，将内壁附着的锅垢除去，注意不要擦伤表面的镀锡。(2) 单蒸馏水器初馏液一般含有较多的低沸挥发性物，而剩余水中有高沸性的挥发物，故最初与最后蒸出的水均应弃之不用。(3) 蒸馏器使用完毕后，应趁热将锅内余水放尽，使用前再放入新鲜水，以免盐类及垢物沉积，不易清洗；(4) 蒸馏水应按药典注射用水质量检查合格后方可应用。在生产过程中仅抽查 pH 、 Cl^- 、重金属及铵盐即可；(5) 蒸馏水的受器最好采用中性玻璃瓶，充分洗净后再用。盛满后应立即用洁净的塞子塞紧；(6) 制造注射用水的室内应保持清洁。

(四)用离子交换树脂制备注射用水和电渗析技术的应用见本章第七节

(五)注射用水的贮存

注射用水不论什么方法制备，最好都用新鲜的配制注射剂。但由于实际条件的限制往往需要贮存一定时间。貯水容器以密闭的耐酸碱的陶土或搪玻璃之类的容器为宜，一般配制1~20 ml 注射液的注射用水可貯放在硬质耐酸碱的中性玻璃瓶中，以磨砂玻璃塞塞盖，盖上用塑料布包扎。若在12小时内配液则不必冷室，否则应将貯液并置冷室，温度保持2°~10°，貯水时间不超过24小时。

二. 注射用油

(一)注射用油的质量要求

中国药典规定的注射用油应无异臭，无酸败味；色泽不得深于4号标准比色液；在10°时应保持澄明；皂化价为185~200，碘价78~128，酸价应在0.56以下，对油料查应成澄明溶液。凡能符合上列药典要求，本身无毒，在注射用量内对人体无害，不影响主药的疗效，并能被组织所吸收者，都可选为注射用油。注射用油以冷压法制得者较好，常用的有麻油、花生油、茶油等。

(二)植物油的精制法

(1)中和植物油中游离脂肪酸。先测定酸价，根据测得的结果加比计算量大10~20%的氢氧化钾（或钠），

配成约35%的溶液；另将油置蒸汽夹层锅中，加入上述碱液并不断搅拌，缓缓升温至60~70°，保持30分钟左右，静置过夜。

(2)油皂分离，取样测定油液酸价（在0.3以下），合格后即行过滤。

(3)脱色脱臭，取上述滤清的油液，在搅拌下加热至50°，加入油量3%的活性白陶土及0.5%活性炭（两者用前均经120°-

小时烘干)，继续加温至 80° ，停止加温，继续搅拌30分钟，静置过夜。用板框压滤机过滤至油液完全澄明，经酸价、水分、杂质等项目检查合格后即得。

(4)精制后的油用干热灭菌法灭菌。

制成品应符合药典注射用油的质量要求。生产中主要控制项目为酸价不大于0.56；水分不超过0.2%；杂质不超过0.2%。

有些在水溶液中不稳定的药物，有时也用油为溶剂以防止其分解变质，例如二巯基丙醇溶于水而不溶于油，但因在水溶液中很不稳定，将其溶于苯甲酸苄酯中，再与油混合制成澄明溶液。也有时用油作溶剂是为了达到长效的目的。

脂肪油局部注射后有时会引起局部组织反应如产生红肿，甚至尚能损害神经，引起疼痛等。

(三) 注射用油的贮存

注射用油应贮存于避光洁净的容器中；应密闭以避免与空气、日光的接触。注射用油在贮存时不得加入抗氧化剂或防腐剂。

三、其他溶剂

注射剂的溶剂除注射用水、注射用油外，尚有其他注射用溶剂，如乙醇、甘油、丙二醇、聚乙二醇、二甲基乙酰胺、苯甲酸苄酯、油酸乙酯等。

(一) 乙醇

本品与水、甘油、挥发油等可任意混合。

毒性：对小白鼠的 LD_{50} 静脉注射为 1.973 g/kg ，皮下注射为 8.285 g/kg 。

采用乙醇为注射用溶剂时浓度可高达50%，可供肌肉或静脉注射，但浓度超过10%肌肉注射就有疼痛感。

有些药物在水中溶解度小而在乙醇中溶解度较大的，或在水中易水解而在乙醇中较稳定的可用适量乙醇为溶剂。如洋地黄毒甙

6~14

注射液(含50%乙醇)、氯化可的松注射液(含50%乙醇)、12.5%
氯霉素注射液(含25%乙醇)、西地兰注射液(含7.4%乙醇)等。

(二) 甘油

本品与水或乙醇可任意混合。在乙醚、氯仿、挥发油、脂肪油中均不溶。

毒性：对小白鼠的 LD_{50} 皮下注射为10 ml/kg，肌肉注射为6 ml/kg，大白鼠静脉注射 LD_{50} 为5~6 g/kg。

本品由于粘度、刺激性等原因不能单独作为注射用溶媒，利用它对许多药物具有较大溶解度的特性，常与乙醇、丙二醇、水等同时应用，如12.5%氯霉素注射液(含55%甘油)、洋地黄毒甙注射液(含30%甘油)、西地兰注射液(含15%甘油)。

(三) 丙二醇

本品与水、丙酮、乙醇、甘油相混溶，并且溶于乙醚。能溶解很多种挥发油，但不能与脂肪油相混溶。

一般情况下稳定，但高温下(250°以上)可被氧化成丙醛、乳酸、丙酮酸及醋酸。

毒性：小鼠腹腔注射的 LD_{50} 为9.7g/kg，皮下注射 LD_{50} 为18.5g/kg，静脉注射 LD_{50} 为5~8g/kg。

丙二醇已广泛用作注射用溶媒，英国药典(1968)已经收载。其特点是溶解范围较广，可供肌肉、静脉等给药。

采用丙二醇为溶媒的注射液如吡嗪土霉素注射液(含50%丙二醇)、氯霉素注射液(含82.6%(g/g)丙二醇)、复方氨基比林注射液(含30%丙二醇)、茶苯明注射液(含50%丙二醇)、异羟洋地黄毒甙注射液(含40%丙二醇)及醋酸去氧皮质酮注射液(用丙二醇作溶媒)等。

(四) 聚乙二醇(Polyethylene glycols, PEG)

PEG 200, 300, 400, 600 (此数字表示平均分子量)系中等

粘度，无色略有微臭的液体，略有吸湿性。较甘油更不易挥发，化学性稳定，不水解。能与水、乙醇相混合，不溶于乙醚，常与其他溶媒合用。其比重、冰点等如表 6~1 所示：

表 6~1 几种液状聚乙二醇的物理性状

PEG	平均分子量	比 重 ^(20°)	冰点范围	比较吸湿度 甘油 = 100
200	190 ~ 210	1.125	过 冷	70
300	285 ~ 315	"	-15 ~ 8	60
400	380 ~ 420	"	4 ~ 8	55
600	570 ~ 630	—	20 ~ 25	40

毒性：PEG 300、400 常作为注射用溶媒，其急性毒性如表 6~2 所示。

表 6~2 几种液状聚乙二醇的毒性

PEG	试验动物	给药途径	LD ₅₀ (g/kg)
300	大白鼠	静 注	7.979
300	"	腹腔注射	19.125
400	小白鼠	"	4.2

PEG 300、400 常作为注射用溶媒。大白鼠皮下注射 PEG 400 10ml (人体剂量的 10 倍) 未见持久的损害，其结果与丙二醇相似。但是大白鼠肌肉注射人体剂量 5~10 倍量的 PEG 300 时能使局部肌肉产生化学性炎症坏死，并发现 PEG 300 尚有溶血作用。

采用 PEG 作溶媒的注射液如洋地黄毒甙注射液 (用 PEG 300 作溶媒)、毒毛旋花子甙 G 注射液 (用 PEG 300 作溶媒)、苯甲酸雌二醇注射液 (用苯甲酸: PEG 300 1:1 作溶媒)、黄体酮注射液 (用丙二醇: 苯甲酸: PEG 300 1:1:1 的混合

6~16

溶媒)、噻替派注射液(用PEG 400为溶媒)等。PEG对四环素、肾上腺素、咖啡因、毒毛旋花素、吗啡等尚有延效作用。

(五) 二甲基乙酰胺(Dimethylacetamide, DMA)

本品为澄明的中性液体,能与水、乙醇任意混合,极易溶于有机溶媒和矿油中。

毒性:对小白鼠腹腔注射 LD_{50} 为 $3.236g/kg$ 。本品的慢性毒性:以 $0.1 \sim 0.4 mg/kg$ 敷于狗皮肤上六个月,结果剂量在 $0.1 mg/kg$ 以上的都发生肝损伤症状。

本品溶解范围较广,在生产中用为混溶剂,国内已经试用。但连续使用时,应注意其毒性。采用二甲基乙酰胺作溶媒的注射液如合霉素注射液(约含50% DMA)、土霉素注射液(含50% DMA)。

(六) 苯甲酸苄酯

本品不溶于水及甘油,能与乙醇(95%)、氯仿、乙醚、脂肪油相混合。可用于含油注射液的潜溶剂。如作为二巯基丙醇注射液的潜溶剂。有些药物不溶于油而溶于苯甲酸苄酯,借此而达到与油相混溶的目的,把具有这种作用的溶媒称为潜溶剂,在选择溶媒时应注意到潜溶剂的作用。17- α 羟基黄体酮苯甲酸酯注射液可采用本品与其他脂肪为溶媒。

(七) 油酸乙酯

本品为浅黄色油状液体,有微臭。不溶于水,能与乙醇、乙醚、氯仿及脂肪油等相混合。它的性质与脂肪油相似,仅粘度较小,在5°时仍能保持澄明。能迅速的被组织吸收,但贮存后将变色。英国药典(1968)规定油酸乙酯可用作为丙酸睾酮等七种注射液的溶媒。

采用本品作为激素的溶媒时,可增加药效。如用本品制成的苯丙酸睾酮、丙酸睾酮的注射液,比采用麻油为溶媒的作用