

常用药物辅料手册

主 编： 李捷玮 刘吉祥
副 主 编： 郑坤丽 陈 俊
 王 震 张国庆
 柴逸峰
主编助理： 孙胜利

第二军医大学出版社

内容提要

本手册精选了国内外药物制剂常用的辅料 200 余种,重点介绍了辅料的中英文名称、分子式与分子量、结构式、制法、性状、质量标准、用途、应用实例、配伍禁忌、毒性、贮运等内容。是一本资料新颖、齐备,内容丰富、翔实的工具书,特别对开发新剂型、新制剂以及新产品具有指导意义。主要读者对象为从事新药及药用辅料研究与开发人员,以及医药制造工业及医院制剂工作者。

图书在版编目(CIP)数据

常用药物辅料手册/李捷玮,刘吉祥主编. —上海:第二军医大学出版社,2000.6
ISBN 7 - 81060 - 068 - 0

.常... . 李... 刘... .药物 - 辅助材料 - 手册 .TQ460.4 - 62

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2000)第 23359 号

常用药物辅料手册

主 编:李捷玮 刘吉祥

责任编辑:尹 茶

第二军医大学出版社出版发行

(上海市翔殷路 800 号 邮政编码:200433)

全国各地新华书店经销

上海市崇明晨光印刷厂印刷

开本: 787 × 1092 1/32 印张:14.75 字数:320 000

2000 年 6 月第 1 版 2000 年 6 月第 1 次印刷

印数:1 ~ 3 000

ISBN 7-81060-068-0/T · 001

定价:28.00 元

前 言

任何一种原料药在临床应用前,必须制成一定的剂型,而制剂的制备过程中除原料药(通常称为主药)外,还须加入一些有助于制剂成型、稳定、增溶、助溶、缓释的具有不同功能和作用的各种辅助材料。通常把这些用于制造或调配药物制剂时必需的辅助材料统称为药用辅料或药物辅料。

药用辅料本身绝大部分不具备药理活性和治疗作用,使用药用辅料的目的在于把药物制成各种制剂。从某种意义上说,一种药用辅料的开发,其意义远超过一种新药的开发。在药物制剂制备过程中,药用辅料选用是否得当,将直接影响药物的生物利用度、毒副作用、不良反应的严重程度以及临床药效的发挥。

也许是“药用辅料”一词中的“辅”字误导了人们对药用辅料在药物制剂中的作用与地位的认识,使得关于药用辅料的可以查阅的学术专著甚少,这势必影响到我国药用辅料及药物新剂型、新制剂的研究与开发。本手册的编写出版,旨在对我国的医药教研、制剂生产及药用辅料研究开发等方面能起到积极的推进作用,希望本书能够成为医药院校、科研院所、医药

制造工业以及医院的药学专业技术人员的一本参考工具书。

在本手册的编写过程中,我们参考了国内外有关的文献资料和书籍,由于篇幅所限,未能逐一列出,谨向原作者及出版单位致歉。本书得到了第二军医大学药学院院长张万年教授和解放军药学情报中心金进教授的指点,王守龙、李秀成、王吴军、刘齐睿等同志参加了部分编写工作,在此一并深表谢意。

由于编者水平有限,疏漏、错误和欠妥之处在所难免,热切期望广大读者批评指正,以便再版时得以订正。

编 者

1999年12月于上海

目 录

1 阿拉伯胶	(1)
2 桉油	(3)
3 白凡士林	(4)
4 苯甲酸	(8)
5 苯甲酸苄酯	(10)
6 苯甲酸钠	(11)
7 苯甲酸乙酯	(16)
8 苯乙醇	(17)
9 苯扎氯铵	(18)
10 苯扎溴铵	(19)
11 变性淀粉	(21)
12 丙二醇	(22)
13 丙酸乙酯	(27)
14 丙酮	(29)
15 丙烷	(32)
16 丙烯酸树脂 I	(33)
17 丙烯酸树脂	(35)
18 丙烯酸树脂	(37)
19 丙烯酸树脂	(39)
20 丙烯酸树脂 E30	(41)
21 薄荷油	(43)
22 泊洛沙姆	(46)
23 虫胶	(49)
24 醋酸苯汞	(53)
25 醋酸纤维素	(55)
26 靛蓝	(56)

27 淀粉	(58)
28 1,3-丁二醇	(60)
29 丁酸乙酯	(61)
30 丁酮	(62)
31 丁烷	(63)
32 丁酸	(65)
33 对氨基苯甲酸	(66)
34 对氯苯酚	(67)
35 对氯间二甲酚	(68)
36 对氯间甲酚	(70)
37 对羟基苯甲酸丙酯	(71)
38 对羟基苯甲酸丁酯	(72)
39 对羟基苯甲酸甲酯	(74)
40 对羟基苯甲酸乙酯	(75)
41 二甲硅油	(78)
42 二甲基亚砷	(80)
43 N,N-二甲基乙酰胺	(81)
44 N,N-二甲基硬脂酰胺	(84)
45 二氯二氟甲烷	(85)
46 二氯四氟乙烷	(87)
47 二叔丁基羟基甲苯	(89)
48 二乙醇胺	(91)
49 二乙酰单酰甘油	(93)
50 二氧化钛	(94)
51 二氧化碳	(96)
52 二氧化硅	(97)
53 粉状纤维素	(99)
54 甘草甜素二钠	(100)
55 甘露醇	(101)
56 甘油	(105)

57 谷胱甘肽	(112)
58 硅酸	(113)
59 硅酸钙	(114)
60 硅酸镁	(116)
61 硅酸镁铝	(117)
62 硅橡胶	(119)
63 硅藻土	(120)
64 果胶	(122)
65 海藻酸	(123)
66 海藻酸钙	(125)
67 海藻酸钾	(127)
68 海藻酸钠	(128)
69 糊精	(131)
70 -胡萝卜素	(134)
71 琥珀酸	(135)
72 滑石粉	(137)
73 环糊精	(140)
74 黄凡士林	(142)
75 黄原胶	(144)
76 活性炭	(147)
77 活性氧化铝	(149)
78 甲酚	(150)
79 甲基纤维素	(151)
80 甲壳素	(154)
81 间苯二酚	(155)
82 焦糖	(157)
83 焦亚硫酸钠	(158)
84 聚山梨醇酯-20	(161)
85 聚山梨醇酯-40	(163)
86 聚山梨醇酯-60	(164)

87 聚山梨醇酯-65	(167)
88 聚山梨醇酯-80	(169)
89 聚维酮碘	(173)
90 聚酰胺	(175)
91 聚氧乙烯	(177)
92 聚乙二醇	(178)
93 聚乙烯醇	(184)
94 聚乙烯吡咯烷酮	(187)
95 枸橼酸	(192)
96 枸橼酸钾	(198)
97 枸橼酸钠	(200)
98 卡波姆	(206)
99 抗坏血酸	(210)
100 抗坏血酸钠	(213)
101 可可脂	(215)
102 可灭菌玉米淀粉	(217)
103 可压糖	(218)
104 亮蓝	(220)
105 邻苯二甲酸醋酸纤维素	(221)
106 磷酸	(224)
107 磷酸二氢钾	(226)
108 磷酸二氢钠	(228)
109 磷酸钙	(230)
110 磷酸氢二钾	(232)
111 磷酸氢二钠	(233)
112 磷酸氢钙	(235)
113 硫代硫酸钠	(237)
114 硫柳汞	(240)
115 硫酸钙	(243)
116 氯化镁	(245)

117 卵磷脂	(247)
118 明胶	(249)
119 没食子酸	(254)
120 没食子酸丙酯	(255)
121 没食子酸辛酯	(257)
122 没食子酸乙酯	(258)
123 木糖醇	(259)
124 硼酸苯汞	(261)
125 葡聚糖	(262)
126 葡萄糖	(263)
127 羟丙基甲基纤维素	(266)
128 羟丙基甲基纤维素邻苯二甲酸酯	(269)
129 羟丙基纤维素	(271)
130 羟乙基甲基纤维素	(274)
131 羟乙基纤维素	(276)
132 壬苯聚醇-10	(277)
133 肉桂醛	(280)
134 乳化蜡	(281)
135 -乳糖	(282)
136 三氯叔丁醇	(285)
137 三乙醇胺	(287)
138 山梨醇	(291)
139 山梨酸	(294)
140 山梨酸钾	(296)
141 十二烷基硫酸钠	(297)
142 石蜡	(300)
143 十六醇	(301)
144 失水山梨醇单油酸酯	(303)
145 失水山梨醇单月桂酸酯	(307)
146 失水山梨醇单棕榈酸酯	(309)

147	叔丁基对羟基茴香醚	(310)
148	双三氯酚	(312)
149	水杨酸	(313)
150	羧甲基纤维素钙	(317)
151	羧甲基纤维素钠	(319)
152	碳酸钙	(324)
153	碳酸镁	(328)
154	糖精	(329)
155	糖精铵	(331)
156	糖精钠	(332)
157	微晶蜡	(335)
158	微晶纤维素	(339)
159	无水碳酸钠	(342)
160	无水羊毛脂	(343)
161	五氧化二磷	(348)
162	西黄芪胶	(349)
163	硝酸苯汞	(351)
164	亚甲蓝	(355)
165	亚硫酸钠	(356)
166	亚硫酸氢钠	(359)
167	烟酰胺	(363)
168	胭脂红	(366)
169	羊毛醇	(367)
170	药用氧化铁黑	(370)
171	药用氧化铁紫	(371)
172	叶绿素	(372)
173	液体石蜡	(373)
174	异丙醇胺	(375)
175	异丁醇	(376)
176	乙醇	(377)

177 乙二胺	(381)
178 乙二胺四乙酸	(382)
179 乙二胺四乙酸二钠盐	(383)
180 乙二胺四乙酸钙二钠盐	(386)
181 乙二醇	(388)
182 乙基纤维素	(390)
183 乙酸苜酯	(393)
184 乙酸桂酯	(394)
185 乙酸异戊酯	(395)
186 乙酸乙酯	(397)
187 乙酰胺	(399)
188 乙酰乙酸乙酯	(400)
189 硬脂	(402)
190 硬脂酸	(404)
191 硬脂酸单酰甘油	(408)
192 硬脂酸钙	(410)
193 硬脂酸铝	(411)
194 硬脂酸镁	(412)
195 硬脂酸钠	(414)
196 油酸三酰甘油	(416)
197 油酸乙酯	(417)
198 玉米朊	(418)
199 预凝胶淀粉	(420)
200 月桂醇	(422)
201 月桂氮 酮	(423)
202 月桂酸	(425)
203 月桂油	(426)
204 蔗糖	(427)
205 正丁醇	(430)
附录一	(432)

附录二	(433)
附录三	(438)
附录四	(440)
附录五	(441)
附录六	(442)
附录七	(442)
附录八	(443)
附录九	(445)
附录十	(446)
附录十一	(447)
附录十二	(448)
附录十三	(450)
中文名称索引	(451)
英文名称索引	(456)

阿拉伯胶

Acacia

【别名】 Gum Acacia; Gum Arabic

【分子式与分子量】 分子式略。分子量为 240 000 ~ 580 000。

【制法】 为阿拉伯树的自然分泌物,干燥而得。

【性状】 为白色粉末或薄片状、球滴状,多角型碎块,质脆易碎,无臭,无刺激味。具有高分子电解质的特性。可溶于水、甘油和丙二醇,不溶于乙醇。1.5%的胶浆 pH 为 2.6,5%乙醇溶液 pH 为 4.5 ~ 5.0,相对密度 1.35 ~ 1.49。溶液经长时间加热或放置粘度降低,且易受细菌和酶的作用而降解。

【质量标准】 USP .NF,1990

鉴别	阳性
微生物	不得检出沙门氏菌
水分	15.0 %
全部灰分	4.0 %
酸不溶灰分	0.5 %
水不溶物	1.0 %
砷	0.0006 %
铅	0.001 %
重金属	0.004 %

淀粉和糊精 应符合规定

鞣酸及有关树脂 应符合规定

【用 途】 在药物制剂中用作乳化剂、增稠剂、助悬剂、粘合剂、明胶胶囊的稳定剂、缓释材料和微囊囊膜材料。作乳化剂和助悬剂使用时浓度一般为 5 % ~ 10 % , 作粘合剂使用浓度一般为 1 % ~ 5 % 。阿拉伯胶的乳化速度极快, 但分散度较小, 一般与西黄芪胶、白芨胶合用, 以增加乳剂的粘度。阿拉伯胶与西黄芪胶的最适比例为 1 : 15。

【应用实例】

1. 鱼肝油乳剂

处方:

鱼肝油	500 ml
阿拉伯胶	125 g
西黄芪胶	7 g
挥发杏仁油	1 ml
糖精钠	0.1 g
氯仿	2 ml
蒸馏水	加至 1 000 ml

制法: 干胶法: 取鱼肝油与阿拉伯胶粉于乳钵中研磨, 加入蒸馏水 250 ml 后, 迅速向同一方向研磨, 直至形成稠厚的初乳, 再加糖精钠水溶液、挥发杏仁油、氯仿、西黄芪胶浆与蒸馏水至 1 000 ml, 搅匀即得。 湿胶法: 先将阿拉伯胶粉与水混合形成胶浆, 再将油相分次少量加入, 在乳钵中研磨, 乳化形成初乳(油、水、胶的比例也是 4 : 2 : 1), 再添加其余成分至足量。

2. 液体石蜡乳剂

处方:

液体石蜡	50 ml
阿拉伯胶	12.5 g
糖精钠	5 mg
苯甲酸溶液	2.5 ml
香兰素	50 mg
氯仿	0.25 ml
水	加至 100 ml

【配伍禁忌】 与乙醇、肾上腺素、氨基比林、安替比林、愈创木酚、次硝酸镁、硼砂、甲酚、丁香油酚、百里酚、阿托品、阿扑吗啡、可卡因、莨菪碱、高铁盐、吗啡、苯酚、毒扁豆碱、鞣酸、香草酚、硅酸钠、肥皂和香草醛等有配伍禁忌。许多盐类能降低阿拉伯胶的粘度,三价金属盐可能使其凝聚。

【毒 性】 无毒,但阿拉伯胶如注射有中毒危险,故不宜作注射用。

【贮 运】 置于阴凉、干燥处。

桉 油

Eucalyptas Oil

【别 名】 桉叶油;桉树油;蓝桉叶油

【制 法】 从桃金娘科植物蓝桉新鲜叶中经水蒸气蒸馏而得的挥发油。

【主要成分】 主要为桉叶素(70% ~ 80%),还有少量

的 -蒎烯、水芹烯、茨烯、萜品醇、乙酸香味醇、香茅醛和胡椒酮等。

【性状】 为无色或淡黄色的液体,有特异的芳香气,微似樟脑,贮存日久,色稍变深。在 70 % 乙醇中易溶。相对密度应为 0.895 ~ 0.920,折光率应为 1.458 ~ 1.468。

【质量标准】 中国药典,1995

鉴别	阳性
水茴香烃	应符合规定
重金属	0.001 %
含量(以 $C_{10}H_{18}O$ 计)	70 % (g/g)

【用途】 在药物制剂中用于内服制剂的芳香矫味,由于兼有防霉、杀菌、防腐作用,可在局部外用制剂中用作着香剂和防腐剂。

【配伍禁忌】 与氧化剂、碱类药物有配伍禁忌。

【毒性】 无毒, $LD_{50} > 5.0 \text{ g/kg}$ (兔子)。

【贮藏】 密封,置于阴凉、干燥处。

白凡士林

White Vaseline

【别名】 白矿蜡;白软石蜡;白半固体石蜡; White Petrolatum; White Semi solid Paraffin

【制法】 从石油中分离得到。经过脱色处理。

【性状】 为白色均匀的软膏状物,无臭或几乎无臭,与皮肤接触有滑腻感,具有一定的拉丝性。在约 35 的苯中易溶,在约 35 的氯仿中溶解,在乙醚中微溶,在乙醇或水中

几乎不溶。熔点为 45 ~ 60 。

【质量标准】	中国药典, 1995	USP .NF, 1990
颜色	应符合规定	应符合规定
杂质吸收度 (290 nm)	0.50	/
炽灼残渣	应符合规定	0.05 %
硫化物	应符合规定	/

【用 途】 用作软膏的基质。多用于含无色或白色药物的制剂。

【应用实例】

1. 醋酸肤轻松乳膏

处方:

醋酸肤轻松	0.25 g
二甲基亚砷	15 ml
十八醇	90 g
月桂醇硫酸钠	10 g
白凡士林	100 g
液体石蜡	60 g
尼泊金乙酯	1 g
甘油	50 g
蒸馏水	加至 1 000 g

制法: 将月桂醇硫酸钠、尼泊金乙酯、甘油及蒸馏水混合加热至 80 , 缓缓加入至预先加热至同温度的十八醇、白凡士林、液体石蜡等的混合物中, 快速搅拌, 冷凝。另将醋酸