

膜剂与栓剂的制备

实验目的

膜剂

- 掌握小剂量制备膜剂的方法
- 熟悉常用成膜材料的性质特征

栓剂

- 掌握热熔法制备栓剂的工艺/置换价的测定方法和应用
- 熟悉处方中所用基质在栓剂制备中的特点

实验指导-膜剂

- 定义：指药物溶解或均匀分散在成膜材料中制成的薄膜状剂型。

特点：

- 药物含量准确，稳定性好，吸收较快；
- 应用方便，多种给药途径；
- 体积小，重量轻，用面积控制载药量；
- 工艺简单，无粉尘飞扬。

适合于小剂量的药物

单层膜

多层膜

夹心膜

膜剂

实验指导

成膜材料 生理惰性，性能稳定，成膜、脱膜性好等

天然高分子材料

明胶、阿拉伯胶、CMC-Na、琼脂、海藻酸钠等
多数可降解或溶解，成膜性能较差，常与其他成膜材料合用

合成高分子材料

乙烯类和丙烯类分子聚合物，例如PVA，PVP，EVA等

PVA (聚乙烯醇)：—[CH₂CH(OH)]_n—

国内常用规格：PVA05-88

PVA17-88

水溶性大

水溶性小

柔韧性差

柔韧性好

可单用，也可采用适当比例混合使用

实验指导

制备工艺

匀浆制膜法（涂膜法）

大生产：脱模机（流涎法）

小生产：刮板法

制膜流程：成膜材料浆液 → 加入药物、着色剂等 → 脱泡 → 涂膜 → 干燥 → 脱膜 → 含量测定 → 包装

热塑制膜法

橡皮滚筒混炼

药物细粉+成膜材料 → 热压成膜；

成膜材料（热熔状态）+药物细粉 → 均匀混合 → 涂膜，冷却

复合制膜法

这种方法一般用机械设备制作，一般用于缓释膜的制备。

以不溶性的热塑性成膜材料（如EVA）为外膜

水溶性的成膜材料用匀浆制膜法制成含药的内膜带

膜剂

实验内容-甲硝唑膜剂

治疗口腔溃疡

■ 处方

甲硝唑	0.3g
PVA(17-88)	5g
甘油	0.3g
蒸馏水	50ml

处方分析

主药

成膜材料

增塑剂

膜剂

实验内容-甲硝唑口腔溃疡膜

■ 操作步骤

取配好的PVA胶
浆溶液**50ml**

保温去泡

稍冷，粘
度较大

制膜

先加入甘油稍搅拌使其均匀，
再加入甲硝唑(研细)，置于
60°C水浴锅上加热溶解。

玻璃板洗净、擦
干、撒上滑石粉
为“脱模剂”

将配好的
溶液倒在
玻璃板上
用刮板法
制膜，厚
度约为
0.3mm。

80°C, 20min

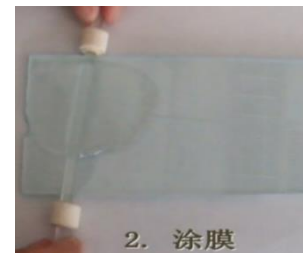
脱膜

烘干

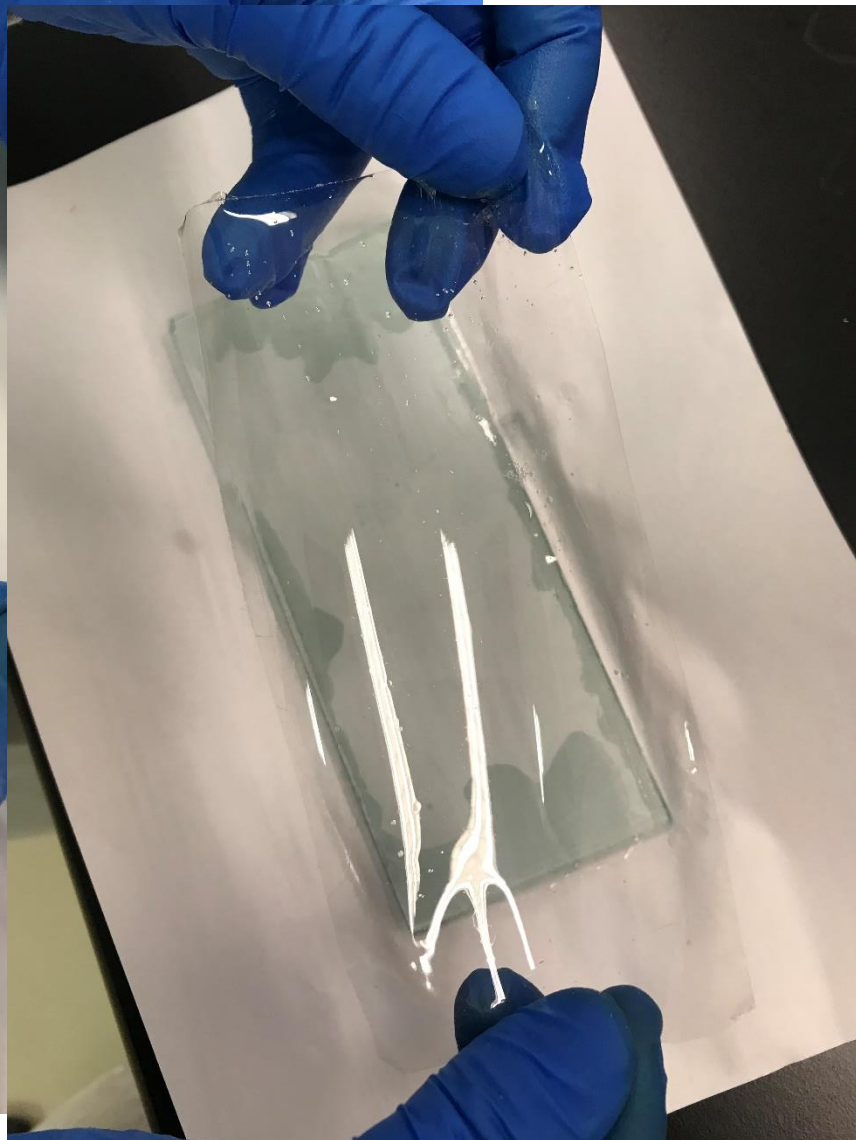
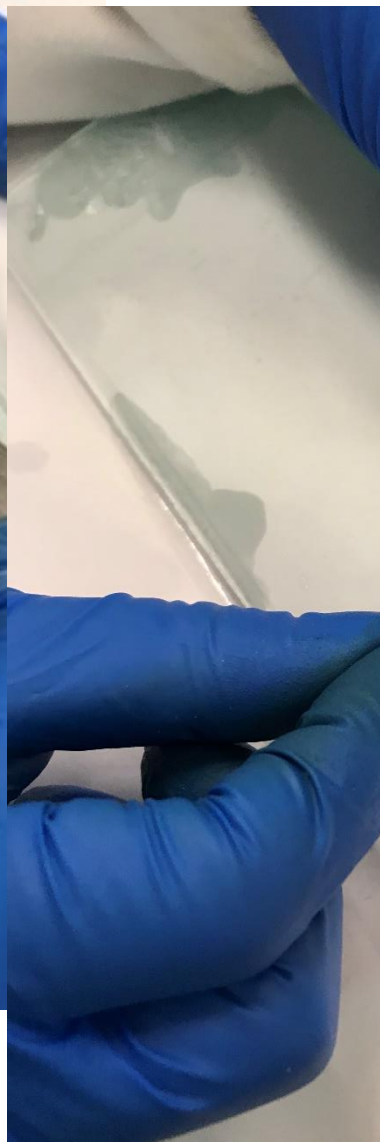
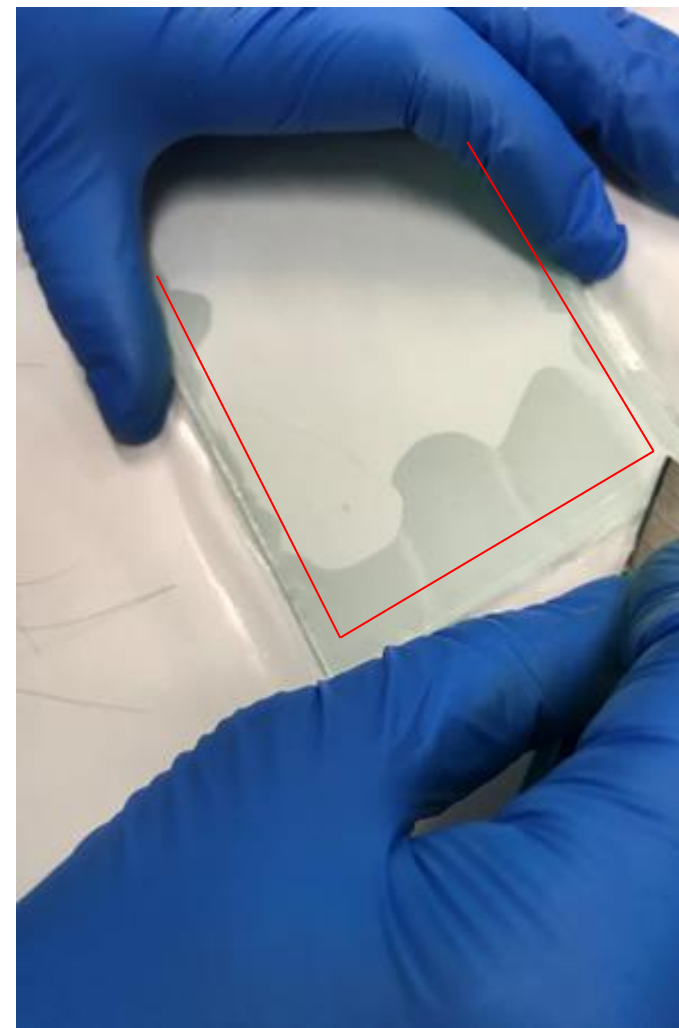


至触摸不粘手

膜剂



脱模



膜剂

质量检查

外观

✓ 外观完整光洁

✓ 厚度一致

✓ 色泽均匀

✓ 无明显气泡

微生物限度检查

重量差异

实验指导-栓剂

- 定义：指将药物与适宜的基质制成具有一定形状供腔道给药的固体状外用制剂。

优点

- ✓ 可用作局部作用或全身作用。
- ✓ 全身作用时可避开肝脏的首过作用
- ✓ 不受胃肠道消化酶的影响。

质量要求

- ✓ 药物与基质混合均匀；
- ✓ 外形圆整光滑，硬度适宜；
- ✓ 无刺激性，塞入腔道后能融化、软化或溶解，并与分泌液混合，逐步释放出药物。

栓剂

实验指导

基质



油脂性基质

➤ 可可豆脂

熔程：31~34 °C，体温能迅速融化

同质多晶型： α (17°C)、 β (34°C)、 β' (26°C)、 γ (23°C)

加热至2/3融化后停止加热，用余热使之全部融化

➤ 半合成或全合成脂肪酸甘油酯



水溶性基质

➤ 甘油明胶

➤ 聚氧乙烯（40）单硬脂酸酯类

➤ PEG

➤ 泊洛沙姆类

栓剂

实验指导

制备工艺



冷压法



搓捏法



热熔法



➤ 工艺流程：熔融基质，加入药物（混匀）注模（加润滑剂），冷却，刮削等。

➤ **润滑剂**：水溶性基质：油性润滑剂，如液状石蜡、植物油

油脂性基质：软肥皂、甘油、90%乙醇（1：1：5）制成的溶液。

➤ **置换价（displacement value, DV）**

药物的重量与同体积基质重量的比值称为该药物对基质的置换价。

$$DV = \frac{W}{G - (M - W)}$$

$$x = \left(G - \frac{W}{DV} \right) \times n$$

栓剂

实验内容-吲哚美辛栓剂

■ 处方

用于小儿退热、老人及昏迷不能自主服药的患者

处方分析

吲哚美辛（100目）

1g

主药

可可豆脂

约?g (DV=1.7)

油脂性基质

共制成肛门栓

10粒

栓剂

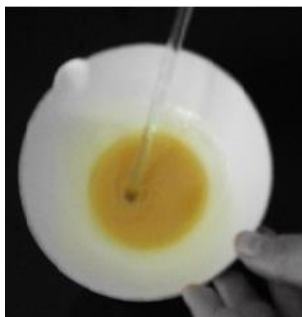


操作步骤

趁热用纸巾处理残余基质！



可可豆脂置于蒸发皿中



加入吲哚美辛混合均匀



一边搅拌一边倾入涂有润滑剂的栓模中至稍溢出模口

40°C水浴加热至2/3熔化，停止加热，用余热使之全熔

放冷至一定稠度

冷却至完全固化 → 削去溢出部分 → 开模取出



质量检查

➤ 外观

应光滑，无裂缝，不起霜或变色，从纵切面观察应混合均匀；

➤ 重量差异

➤ 融变时限

➤ 微生物限度

➤ 药物溶出速度和吸收试验

➤ 稳定性和刺激性试验



注意事项

- ◆ **膜剂-实验前先溶解甲硝唑，超声+加热**
- ◆ **栓剂-可可豆脂留有部分晶核，停止加热，用余热使之全熔**
- ◆ **栓剂残余基质趁热用纸巾处理**

思考题

- 吲哚美辛栓剂制备中应注意哪些问题？
可可豆脂的用量是怎么计算出来的？
- 小量制备膜剂的操作应该注意哪些问题？
为什么？处方中甘油作用是什么？