

后时间与起效时间显著相关 ($Y = 0.1706X + 1.1707$, $r = 0.9110$, $n = 6$, $P < 0.01$), 这表明在研究经皮局麻制剂时, 如采用离体实验结果进行处方筛选, 滞后时间比渗透速率具有更为重要的意义。

参考文献

- 1 McCafferty DF, Woolfson AD, McClelland KH, *et al.* Comparative *in vivo* and *in vitro* assessment of the percutaneous absorption of local anaesthetics. *Br J Anaesth*, 1988, 60(1):64.
- 2 McCafferty DF, Woolfson AD. New patch delivery system for percutaneous local anaesthesia. *Br J Anaesth*, 1993, 71

(3):370.

- 3 Menon GN, Norris BJ. Simultaneous determination of tetracaine and its degradation product, *p-n*-butyl-aminobenzoic acid, by high performance liquid chromatography. *J Pharm Sci*, 1981, 70(5):569.
- 4 Kano T, Hashiguchi A, Nakamura M, *et al.* A comparative study of transdermal 10% lidocaine gel with and without glycyrrhetic acid monohemiphthalate disodium for pain reduction at venous cannulation. *Anesth Analg*, 1992, 74:535.
- 5 McCafferty DF, Woolfson AD, Boston V. *In vivo* assessment of percutaneous local anaesthetic preparations. *Br J Anaesth*, 1989, 62(1):17.

(收稿:1996-11-11)

胃镜检查用局麻消泡剂的研制

陆珠英 (上海 200120 上海东方医院)

摘要 目的:研制胃镜检查用麻醉消泡剂。方法:由达克罗宁、山莨菪碱、硅油、西黄蓍胶、脱水山梨醇油酸酯-80、甘油等原料组成,采用干胶法制成口服乳浊液,并对处方中西黄蓍胶、脱水山梨醇油酸酯-80、硅油的用量作了系列探索,使乳浊液稠度适宜,消泡显著,镜检视野清晰。结果:该乳浊液用于胃内窥镜直视检查时获得较好的临床效果。结论:该 *po* 乳浊液用作胃镜检查时的局麻消泡是可行的。

关键词 消泡;麻醉;HLB;达克罗宁;山莨菪碱;脱水山梨醇油酸酯-80;西黄蓍胶;硅油

The research of local analgesic antifoam agents in fibergastroscope examination

Lu Zhuoying (Lu ZY) (Shanghai Oriental Hospital, Shanghai 200120)

ABSTRACT OBJECTIVE: To make oral emulsion liquor for anaesthesia and antifoam in fibergastroscope examination. **METHODS:** Dyclonine, anisodamine, dimethicon, tragacantha, sorbitan oleate-80, glycerol were used. The amount of tragacantha, sorbitan oleate-80, dimethicon in the formula was regulated to make emulsion liquor have suitable dense and thickness, remarkable antifoam ability. **RESULTS:** Best clinical results in fibergastroscope examination were obtained. **CONCLUSION:** The method for preparation of oral emulsion liquor for anaesthesia and antifoam in fibergastroscope examination is applicable.

KEY WORDS antifoam, anaesthesia, HLB, dyclonine, anisodamine, sorbitan oleate-80, tragacantha, dimethicon

我院胃镜室作胃内窥镜直视检查时,一般常用 $10\text{ g}\cdot\text{L}^{-1}$ 地卡因溶液喷喉,肌注山莨菪碱。该法操作麻烦,胃镜视野清晰度不理想,难发现病灶。从 1996 年 3 月起,我院制剂室研制胃镜剂,选用达克罗宁、山莨菪碱、硅油、西黄蓍胶、脱水山梨醇油酸酯-80、甘油、单糖浆,制备成均匀乳浊液,于胃镜检查前 $3\text{ min}\sim 5\text{ min}$,让

中国药学杂志 1997 年 12 月第 32 卷第 12 期

患者吞服 10 ml (先口含至有麻木感后再吞下)。临床应用一致反映,该局麻消泡剂服用方便,麻醉效果好,消泡显著,视野清晰,现介绍如下。

1 实验材料

试药:达克罗宁(上海轻工实验厂);山莨菪碱(上海民生药厂);脱水山梨醇油酸酯-80(上

Chin Pharm J, 1997 December, Vol. 32 No. 12 · 749 ·

海大众药厂);西黄蓍胶(上海化学试剂厂);硅油(上海试剂厂)。

2 处方设计

2.1 处方组成及各组份简介:本局麻消泡剂的组成为:山莨菪碱 1 g,达克罗宁 10 g,硅油 140 ml,羟苯乙酯 1 g,西黄蓍胶 12 g,甘油 100 ml,脱水山梨醇油酸酯-80 6 ml,单糖浆 100 ml,蒸馏水加至 1 000 ml。其中,达克罗宁:起麻醉作用,其麻醉深度强,毒性低,速度快,维持时间长。山莨菪碱:解痉,止分泌,可减少胃液分泌。硅油:消泡,在常规胃镜检查中,泡沫粘液的存在常常影响视野,干扰窥视,影响微细病灶的判断,而硅油具有表面活性作用,能使泡沫粘液表面张力下降,从而发挥优势的消泡效果。本品 p_o 不吸收,对人体无毒副作用。脱水山梨醇油酸酯-80:乳化剂。西黄蓍胶:增加乳浊液的粘度,起辅助乳化剂的作用。羟苯乙酯:防腐剂。甘油:保湿剂。单糖浆:矫味剂。

2.2 HLB 值计算:当乳化剂 A (HLB 值为 HLB_A) W_A 克与乳化剂 B (HLB 值为 HLB_B) W_B 克混合应用时,其混合乳化剂的 HLB 值(以 HLB_{AB} 表示)计算如下:

$$HLB_{AB} = \frac{HLB_A \times W_A + HLB_B \times W_B}{W_A + W_B}$$

经查阅:硅油 $HLB = 10.5$;脱水山梨醇油酸酯-80 $HLB_A = 4.3$, $W_A = 6$;西黄蓍胶 $HLB_B = 13.2$, $W_B = 12$ 。代入上式中, HLB_{AB} 值为 10.2,与硅油 HLB 值(10.5)很近似,所以硅油能乳化完全。

2.3 稠厚度:乳浊液的稠厚度应适宜,稠度太大,患者服用时容器内的乳浊液不易倾到干净,而且气泡不易消散;稠度太小,不能使药物在局部充分滞留产生药效。

将处方中西黄蓍胶与脱水山梨醇油酸酯-80 按表 1 不同比例配制,混合后,HLB 值始终保持 10.2,处方中其它各成分用量均不变,得到一系列不同稠厚度的乳浊液。经临床应用表明,4,5,6 号乳浊液稠厚度最适中,即西黄蓍胶

的用量适宜范围为 1.2% ~ 1.6%,与之相配的脱水山梨醇油酸酯-80 用量为 0.6% ~ 0.8%。

表 1 脱水山梨醇油酸酯-80 与西黄蓍胶不同配比量

编号	脱水山梨醇油酸酯-80/ml	西黄蓍胶/g	编号	脱水山梨醇油酸酯-80/ml	西黄蓍胶/g
1	3	6	6	8	16
2	4	8	7	9	18
3	5	10	8	10	20
4	6	12	9	11	22
5	7	14	10	12	24

2.4 消泡作用:硅油为消泡剂,要使达到最有效的消泡作用,使镜检视野清晰度高,硅油的用量十分重要。将处方中硅油用量从 6% 逐步增加至 20% (其它成分用量均不变),观察临床消泡效果。结果表明,硅油用量达 10% 时,临床使用才有较明显的消泡作用,达 12% 以上有显著的消泡作用,镜检视野清晰。

3 制备工艺

通过稠厚度、消泡作用的试验,我制剂室在制备胃镜剂时,采用硅油用量 14%,西黄蓍胶 1.2%,脱水山梨醇油酸酯-80 0.6%。参照文献方法[沈阳药学院主编.药剂学.北京:人民卫生出版社,1980:61~62;95~102]制备。

3.1 取西黄蓍胶于干燥钵中,加入脱水山梨醇油酸酯-80 和硅油研磨均匀,一次加入蒸馏水 240 ml,迅速沿同一方向研磨使成乳白色初乳。

3.2 取蒸馏水约 300 ml 加热至 70 左右,加入达克罗宁,羟苯乙酯,搅拌使溶加入甘油 100 ml,搅匀,加入山莨菪碱搅拌使成均匀的混悬液。

3.3 将 3.2 液徐徐加入 3.1 中,边加边研磨,使成均匀乳浊液,最后加入单糖浆,加水至 1 000 ml,充分搅匀后进行分装,每支 10 ml。

4 临床应用

该胃镜剂经我们临床应用了 1 526 个病例,无任何不良反应,局部粘膜有良好的表面麻醉作用,镜检时,绝大多数病人胃内无泡沫性粘液,视野清晰,仅有个别病人有少许泡沫性粘液,胃镜稍作冲洗后,完全可进行观察。

(收稿:1997-01-10)