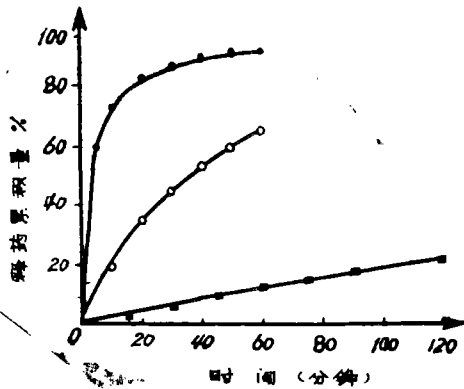


比研究充分说明：微囊的缓释效果相当显著。



注：●：NFT原料药
○：信谊肠溶片片芯
■：混合微囊

图3 原料药，信谊片芯及混合微囊的释药曲线

(四) 微囊含药量(%)与包封率的关系的实验结果见表2。

表2表明：NFT微囊的包封率随含药量的增加而降低。至于得率，由于属实验室小量试制，有粘附等情况，故未计算。

表2 微囊含药量与包封率的关系

批号	理论含药量	实测含药量	包封率
	(%)	$\bar{X} \pm SD$	$\bar{X} \pm SD$
880122A~C	20	13.3 ± 0.40	66.7 ± 0.02
880123A~C	30	17.0 ± 0.32	56.8 ± 0.01
880125A~C	50	26.7 ± 0.47	53.5 ± 0.01

参 考 文 献

1. 戴自英：临床抗菌药理学，北京：人民卫生出版社，1985：361~362
2. 邓幼华等：中国医院药学杂志，1982，2(5)：26
3. Jun·H·W et al: Inter J Pharmaceutics 1983, 16(1) 65
4. Dubernet·C et al: Inter J pharmaceutics 1987, 35(1~2) 145~156。
5. Tsunco et al: Chem pharm Bull 1983 31(8)：2793。
6. 戴养厚等：中国医院药学杂志 1986，6(12)：535
7. 奚念朱等。药剂学，北京：人民卫生出版社，1987：143
8. Higuchi T: J·pharm Sci 1963, 52, 1145~1146

口腔溃疡药膜应用概况

解放军100医院

林惠玉 谢剑锋

口腔溃疡是较常见的口腔病损，发病率较高。临床上常见的有复发型口疮、病毒引起的口腔溃疡及创伤性口腔溃疡等。至今多数口腔溃疡的病因尚属不明。在治疗上，除全身用药外，一般以抗生素、合成抗菌药、激素、维生素及具有清热养阴收敛生肌功效的中药以膜剂形式局部应用为主，并取得一定疗效。鉴于口腔药膜能在水浸后成为溶胶，粘附在粘膜表面，膜内药物的释放持久，保持局部药物有效浓度，并使病损部位得到机械性的保护，故较其他给药方式如含片、散剂、含漱剂等更能减轻痛苦，提高疗效，因

而得到国内外的广泛应用。本文对近年来用于治疗口腔溃疡的药膜作一概略介绍。

一、以抗生素、合成抗菌药、激素为主的药膜

目前口腔溃疡药膜中应用的抗生素计有金霉素、四环素、洁霉素、乙酰螺旋霉素、庆大霉素、新霉素，合成抗菌药有甲硝唑、呋喃唑酮等，激素类有可的松、强的松、氢化可的松、地塞米松等。

1. 复方四环素双层药膜⁽¹⁾ 该膜由四环素、强的松、樟柳碱、地卡因等药物加工制成的膜剂。具有消炎、抗过敏、改善微

循环〈局部〉、止痛和促进溃疡愈合等作用。用于复发性口疮，糜烂型扁平苔癣及创伤性溃疡等的治疗，经临床419例观察，总有效率为96.66%，无副作用。

2. 复方庆大霉素口腔药膜⁽²⁾ 由硫酸庆大霉素、地塞米松、地卡因等药物组成，适用于复发性口疮等各类口腔溃疡。经临床试用402例，止痛迅速，粘着时间长，近期效果好，能明显缩短溃疡愈合期。

3. 复方洁霉素膜剂⁽³⁾ 本膜以盐酸洁霉素、氢化可的松、654-2、VB₂等药物制成的膜剂。经临床观察64例，对口腔粘膜溃疡效果较好，总有效率为100%，一般3~6天内溃疡全部愈合。

4. 乙酰螺旋霉素药膜 乙酰螺旋霉素对G⁺细菌作用力强，进入血液后，在唾液腺、牙龈中分布的浓度很高，而且积蓄的时间较长，是治疗口腔炎的理想药物。

丘克群等报告⁽⁴⁾，乙酰螺旋霉素口腔药膜临床观察162例各种类型口腔溃疡及口炎，都取得满意效果。对复发型口疮及口炎，用药后5天内即愈，总有效率为100%，无不良反应。周幼安报告⁽⁵⁾，以乙酰螺旋霉素为主药，用水溶性高分子物质和水难溶性高分子物质〈丙烯酸树脂Ⅱ号、聚丙烯酰胺、甲基纤维素〉组成药物载体，具有增强粘附性和溶解迟缓性的特点，一般粘附3hr以上，不受进食和说话的影响。该膜涂有保护层，口感良好。临床上主要用于口腔溃疡和各种口腔炎症。一般使用2~5天，对消炎、止痛和促进溃疡愈合有明显疗效。

5. 复方金霉素药膜⁽⁶⁾ 由金霉素、去氢可的松，VA等药物组成。用于各种类型口腔溃疡，贴膜1~2天症状即明显好转，3~4天多可愈合。

6. 甲硝唑药膜 甲硝唑抑制口腔厌氧菌的繁殖，与其他药物配合应用，对口炎及口腔溃疡有很好的疗效。姚雪彪⁽⁷⁾以甲硝唑和樟柳碱为主制成的药膜，可改善局部微

循环，抑制厌氧菌生长，促进溃疡面愈合。临床表明对口腔溃疡和牙周炎疗效显著。张明道等报告⁽⁸⁾，以甲硝唑、左旋米唑、硫酸锌等药物组成的药膜，经150例口腔溃疡疗效观察，总有效率达95.33%。其中42例曾用传统方法治疗无效后改用此膜治疗而收到良好效果。

7. 呋喃唑酮口腔溃疡药膜⁽⁹⁾ 该作者从呋喃唑酮治疗消化性溃疡效果甚佳得到启示，以该药为主制成的药膜治疗54例口腔粘膜溃疡，每天用药三次，2~5天后炎症、疼痛减轻或消失，溃疡逐渐愈合。总有效率为93.1%，尤其对复发性口腔溃疡疗效更好。

二、中西药复方药膜

醋酸洗必泰和青黛、冰片或养阴生肌散组成的复方药膜，用于临床效果满意。戈淑庭等报告⁽¹⁰⁾，复方养阴生肌散药膜用于1000余例口腔溃疡、炎症等，三天内溃疡愈合占39%，有效率为92%，迅速止痛占88%。

(养阴生肌散成份为明腰黄、人工牛黄、黄连、龙胆草、黄柏、薄荷脑、煅石膏、甘草、冰片、青黛)。李国权⁽¹¹⁾以潘生丁、丹参(注射液)、VE、硫酸锌、金霉素等药物制成复方口腔溃疡膜，用于复发型口疮、创伤性口腔溃疡、疮疹性口炎等，临床观察166例，溃疡在3~6天内愈合，总有效率100%。其中45例用其它方法治疗无效，经该膜治疗后收到良好效果。

三、中药口腔药膜

王勤观等报告⁽¹²⁾，以生石膏、青黛、儿茶、雄黄、龙骨、珍珠粉、冰片等中药制成口腔溃疡膜，观察了单纯性口腔溃疡37例，复发型口腔溃疡33例。病程最长者19年，最短者2天，且多数经中、西多种药物治疗无效者，改用本品治疗后，溃疡部位一般在2~7天内即愈合。总有效率为92.6%。

杨相彬等报告⁽¹³⁾，根据蜂胶具有成膜

性的特点, 并有止痛、消炎、促进溃疡面愈合的作用, 以蜂胶为主制成口腔药膜。本膜主要特点是止痛效果快, 维持时间长, 无刺激性, 尤其对创伤性溃疡效果更佳。大多数用药1~2天即可愈合。经临床观察200例, 总有效率为96%。

四、其他

复方溶菌药膜⁽¹⁴⁾: 该膜以卵制溶菌酶和VB₆为主药。临床观察101例复发型口疮、经贴本膜治疗, 每日4~6次, 三天为一疗程, 最多治疗二个疗程, 有效率为87.7%。

复方硫酸锌口腔溃疡药膜⁽¹⁵⁾: 内含硫酸锌、VB₂、地卡因、庆大霉素等药物。临床应用疗效好, 止痛明显, 一般用药1~3天可愈合。

纵观目前用于口腔溃疡的各种药膜, 品种繁多, 对于各类口腔溃疡均有较好的疗效, 对复发型口疮可延长间歇期, 减少复发, 但尚未能达到根治目的, 期望能有疗效更好的药膜出现。

参考文献

1. 沙静珠: 中国药理学杂志1989, 24(1): 52
2. 陈明非等: 中国医院药学杂志1985; 5(5): 36
3. 沈心平等: 中国医院药学杂志1990, 10(1): 34
4. 丘克群等: 口腔医学1988, 8(1): 32
5. 周幼安: 中国药理学杂志1989, 24(10): 602
6. 罗泊: 中华口腔科杂志1984, 19(4): 232
7. 姚雪彪: 中国医院药学杂志1987, 7(5): 233
8. 张明道: 中国医院药学杂志1988; 8(1): 22
9. 颜跃车等: 现代应用医学1989, 6(6): 32
10. 戈淑庭等: 中国医院药学杂志1986, 6(3): 29
11. 李国权: 中国药理学杂志1990; 25(2): 103
12. 王焯观等: 药学通报1987; 22(2): 83
13. 杨相彬等: 中国药理学杂志1989; 24(7): 418
14. 陈汉正: 口腔医学纵横1987; 3(2): 102
15. 姜淑春: 中国医院药学杂志1987; 7(4): 182

· 文摘 ·

丙戊酸及其代谢物的胎盘转运及新生儿消除作用

贾丹兵译

张紫洞校

丙戊酸是一种广泛应用的抗癫痫药物。本品与其它抗癫痫药相同需长期服用。因此, 有些病人服药期间可能受孕。已经有警告说此药可能致畸, 而且在动物试验中已经表明本品的代谢产物之一, 2-丙基-1-戊烯酸是畸形形成的原因。这些报告促使人们对丙戊酸的单不饱和和代谢物透过胎盘而转输到胎儿以及新生儿对其消除进行了研究。

丙戊酸及其单不饱和和代谢物(2-丙基-2-戊烯酸、2-丙基-3-戊烯酸、2-丙基-4-戊烯酸)的血浆浓度, 在四名癫痫孕妇和她们的新生儿中已经进行测定。测定时血样的采集, 在分娩的第一产程中收集母亲的血样, 婴儿娩出后立即取脐血样。所有妇女均已服丙戊酸一年以上者。经发现丙戊酸和三种代谢物的血浓度, 脐带血浆中比在母亲血浆中均约高出1.5倍。令人惊奇的是上述被研

究的四种化合物中脐带和母亲之比例几乎平均相同。

从出生后的二个新生儿中收集的血样, 并且分析丙戊酸及其代谢物。已经发现丙戊酸和2-丙基-2-戊烯酸的血浆浓度在出生后的第一周始终是降低的, 而2-丙基-3-戊烯酸和2-丙基-4-戊烯酸在两个新生儿中表明变化不大。

作者认为: “几份报告已经认为丙戊酸的不饱和和代谢物, 尤其2-丙基-4-戊烯酸, 很可能是由其引起致畸性。这一报告指出2-丙基-4-戊烯酸在胎儿中蓄积, 它可能部分说明了接受丙戊酸治疗的癫痫母亲所生的子女具有畸形的高发病率。然而, 澄清这一个问题需要进一步研究。

[AJP《澳大利亚药学杂志》, 70(7)555, 1989(英文)]