

• 农村园地 •

谈谈中药治疗急症的给药途径、剂型及其作用特点

成都市中医药研究所 冯菊农

治疗急症的药物制剂应具速效和高效，或显速效后保持长效。且应使用安全，剂量和含量准确，疗效稳定，方便及时应用。要能达到以上要求，除恰当选用药物外，给药的途径和剂型起到十分重要的作用。在现代药剂中，具有或基本上具有以上特点的给药途径和剂型有下述几种，并且均可用于中药制剂中，有的已见到成效。

一、注射给药 所用剂型为注射剂，包括静脉推注、滴注或大输液、肌肉注射、穴位注射。此剂型用于中药制剂仅十多年历史，于中国药典 1977 年版收载有 23 个品种。各地制备使用者上千多种。

注射给药主要用以起到全身作用，亦有少数用于产生局部药效。药物经注射入静脉、肌肉后，均经静脉血运至心脏，经肺循环再回到心脏后，由动脉运送至全身。全部动脉中，肝动脉可将药物部分带入肝脏，加上由脾、胰消化道经门静脉带入肝脏的一部分，总共约有 30% 左右的药物要在肝脏代谢。而口服给药时，药物吸收入血后，则 100% 要通过肝脏，故注射给药受肝脏代谢而被破坏的影响较小。

从静脉给药对治疗无法口服给药的昏迷、呕吐重危病人提供了有利剂型。如清开灵一号注射液治疗乙型脑炎、生脉及枳实等注射液抗休克等，均起到了速效、高效作用。将静注液加入葡萄糖注射液或生理盐水中进行滴注，或直接制备成中药大输液应用，现已取得较好效果。如古方增液汤制成的大输液，作为治疗中医温病的养阴增液药物，除具有西药大输液的补液作用外，还具有中药的“救阴”、“保津”作用⁽¹⁾。由于一次可用 500~1,000ml，采用静脉滴入，故较推注维持时间长，是中医治疗急症给药手段的一大革新。作者也制备多种用于临床，取得了较好疗效。

肌肉注射的品种多，使用广泛，有的也确有疗效。如板蓝根注射液用于病毒感染，复方丹参注射液作为活血化瘀药物等。但用量有限，一般不超过 5ml，不如静注或滴注用量大，对需大剂量治疗的疾病不适宜，故多用于一般疾病。穴位注射具有药物和穴位刺激两种作用，有一定疗效。为了使药物有效成分缓慢释放，延长疗效，现已制成细辛挥发油微囊混

悬型注射液，具有较好的止痛延效作用⁽²⁾。

以上一些注射液，虽有较多优越性，但也应本着需要与可能，酌情制备和应用。口服或其它剂型能达到要求的，就不必制成注射剂，更不必静脉注射。因为有些药物尚不宜制成注射剂，有些疾病也不一定非用注射剂。要制法得当，用得其所。因有用后产生过敏反应的报道，故应慎重行事。

二、吸入给药 所用剂型为气雾剂或供雾化使用的雾化液。这也是近十多年才用于中药制剂的一种新剂型。现已有用为中止心绞痛发作的宽胸气雾剂⁽³⁾、麝香气雾剂⁽⁴⁾及治疗气管炎哮喘的芸香油气雾剂等。雾化液为一种用雾化器雾化后供吸入的灭菌液体制剂。作用与气雾剂相同，但无需特殊容器。现已有治疗儿童呼吸道感染的雾化液，取得了较好疗效⁽⁵⁾。

药物雾粒经呼吸道吸入后，可起到局部或全身作用。吸收部位主要是肺泡，因肺泡表面距毛细血管极近，约 0.5~1 μ 。这也是肺吸收迅速的一个重要因素。此外，人体肺泡总数约 3~4 亿，到肺泡的毛细血管总面积约 90m²，这也是肺吸收的有利因素。血液通过肺的循环量很大，也导致药物在肺部的吸收迅速。

三、舌下给药 主要剂型有舌下薄膜和舌下含片。近年来已有万年青舌下薄膜试制应用。此种剂型适宜制备剂量小、作用强的药物。

舌下和其它口腔粘膜，血管分布丰富。药物从舌下粘膜吸收后，通过颈内静脉到心脏，再分布到全身。舌下剂型在舌下放置被唾液溶解后，即可由粘膜吸收，可避免口服给药在胃酸中灭活及通过肝脏的代谢作用，吸收较快，能奏速效。

四、直肠给药 剂型有栓剂、灌肠剂。这些老剂型又有新发展之势。中药栓剂如野菊花栓、野艾叶栓⁽⁶⁾及一些清热解毒、退烧、止痛的栓剂都有一定疗效。灌肠液是供灌入直肠或结肠的液体制剂，如治疗肾功能衰竭的结肠灌注液等⁽⁷⁾。

直肠给药时，药物的吸收主要依赖药物溶于直肠分泌液中，然后透过粘膜而被吸收。制备栓剂应选择适宜基质和药物，方可发挥其特点和作用。灌肠剂作保

☆
专
☆
题
☆
讲
☆
座
☆

留灌肠利于显速效和增高血药浓度,比栓剂吸收好。美国药典19版收载了四种灌肠剂,有的血药浓度与静脉注射相似。

直肠给药有两个吸收途径,一是通过上直肠静脉经门静脉进入肝脏,再由肝脏进入大循环。一是通过中直肠和下直肠静脉进入下腔静脉,绕过肝脏而直接进入大循环。故栓剂置入肛门内2cm左右的深度较好。这样药物的吸收不经过肝脏的量较多。据报道,可不经肝脏直接进入大循环的量为50~75%⁽⁸⁾。若置入6cm深度时,则大部分通过上直肠静脉吸收。结肠灌注时,其吸收途径则是上直肠静脉和结肠静脉。栓剂还具有避免药物对胃粘膜的刺激、不受消化道诸多因素的影响、药物作用时间长、有的吸收较口服给药快而有规律等优点。

五、口服给药 此途径给药的剂型较多,用于治疗急症的有液体制剂和固体制剂。这些剂型应是含提取物(浸膏、有效成份或有效总成份)制成品,使用方便及时。

口服给药的一些剂型有相同的一般吸收机理。药物经口服后是通过由类脂体、脂蛋白、多糖等组成的生物膜(即胃肠粘膜,一般称为胃肠屏障,具有半透膜作用)上的上皮细胞吸收后进入微循环,汇总进入门静脉到达肝脏,经过代谢作用,再进入大循环分布到全身组织而呈现疗效。

口服的不同剂型也有不同的释放吸收情况。固体制剂如散、片等,服后须经过崩解和溶解,只有溶解后方能被上皮细胞吸收。有些片剂虽崩解度好,但困难溶于水,有效成分不能很快从固体制剂中释放溶出,这种溶出速度会直接影响药物的显效时间、作用强度及维持时间。中药散剂一般系用药材研细制成,其吸收不如西药散剂快。因口服进入胃肠道后,需要经过湿润、毛细管作用、渗透、扩散等过程,有效成份才能从生药细胞内释放出来,再根据其溶解情况产生不同的吸收。粉末愈细,吸收愈快。若为浸膏散剂或某些药物如冰片、牛黄、芒硝、熊胆等则无需以上释放过程,故吸收较快。对辟秽丹(散剂)作不同剂型的体外释药试验表明:液体最快,乳剂、栓剂次之,原剂型散剂最差⁽⁹⁾。近代中药片剂有全生药片、部分浓缩片、全提取物片(包括浸膏、提取物、单体等)。对人参茎叶的提取片、水醇法制备的片剂、浸膏片、生药片作生物利用度实验比较,结果表明:体外溶出速度和体内血药浓度以提取片最快、最高,其次是水

醇片、浸膏,最差是生药片⁽¹⁰⁾。

近代新剂型滴丸的制备,是固体分散技术的应用,虽是固体制剂,由于药物(特别是难溶性不易吸收者)在基质中呈现超细状态分散,当这种分散物与体液接触时,因基质的良好可溶性,使药物微粒得到良好的可湿性与分散性,从而在体液中迅速溶解、吸收而显效,较其它固体制剂如片剂、水丸剂等吸收显效快。因能显高效、速效,是一个很有发展前途的新剂型。现用于急症的有治疗心绞痛冠心病的苏冰滴丸⁽¹¹⁾。

中药水浸出液体制剂大多偏酸,pH约在5~7之间,肠液的pH较适合多种成份的溶解(十二指肠pH为5~7,上行结肠为7~8),故对弱酸、弱碱性物质如生物碱、蒽醌、黄酮等均易被吸收。因此,肠道是重要的吸收部位。

液体制剂中加入低浓度的表面活性剂(如0.1%左右的吐温-80)能增加一些难溶性药物的溶解速度,又有溶解脂质的作用,改变上皮细胞的通透性,从而使一些药物的吸收增多。但若浓度太大,则可将药物包于因加吐温时所形成的胶团中,反而会减少被吸收的量,使吸收速度减慢。

参 考 文 献

1. 徐有玲等:中药大输液剂增液针、养阴针的临床和实验初步观察。中国中西医结合研究会四川分会学术交流资料,1981
2. 冯菊农等:细辛微囊止痛针制备工艺的探索与初步临床观察。中国药学会四川分会学术年会资料,1980
3. 郭士魁等:宽胸气雾剂中止心绞痛发作速效作用观察。中西医结合杂志 1(1):9,1981
4. 陕西科技情报研究所:国内外心血管病中草药研究概况。内部资料,12页,1978
5. 沈书萍等:中药超声雾化吸入治疗儿童呼吸道感染60例报告。中医杂志 23(4):24,1982
6. 南京药学院:《药剂学》,554页,1978
7. 叶传惠等:以“中药结肠灌注1号”为主治疗急性肾功能衰竭20例疗效分析。内部资料,1982
8. 南京药学院:《药剂学》,540页,1978
9. 钟立贤等:辟秽丹的剂型改革和不同剂型的体外释药试验。中成药研究 6:15,1980
10. 范成德等:人参茎叶四种片剂的试制及生物利用度的比较。医院药学杂志 2:2,1982
11. 上海中药制药一厂等:冠心苏合丸的剂型改进——苏冰滴丸的试制。医药工业 12:3,1976