

表 1 硫酸丁胺卡那霉素与 5 种药物的配伍变化

组别	0h			2h			4h			6h			8h			24h		
	色泽	pH	含量	色泽	pH	含量	色泽	pH	含量	色泽	pH	含量	色泽	pH	含量	色泽	pH	含量
I	-	4.18	99.00	-	4.19	99.00	-	4.21	99.42	-	4.20	98.86	-	4.24	98.30	-	4.07	98.02
II	-	7.55	99.00	-	7.78	101.73	-	7.84	100.00	-	7.82	98.86	-	7.83	98.16	-	7.76	97.18
III	-	7.35	99.00	-	7.31	188.50	微黄	7.32	196.79	微黄	7.17	98.86	微黄	7.15	92.61	微黄	7.08	91.06
IV	-	5.99	99.00	-	5.98	99.28	-	5.99	93.80	-	5.98	92.75	-	5.98	92.75	-	5.89	90.68
V	-	4.61	99.00	-	4.64	99.14	-	4.67	99.28	-	4.63	99.28	-	4.73	99.28	-	4.56	99.14

注：-表示无色澄明

三、讨论

(一) 硫酸丁胺卡那霉素在 1~20μ/ml 浓度范围内, 浓度的自然对数与抑菌圈直径平方呈线性关系, 相关系数 r=0.9998。

(二) 丁胺卡那霉素 400mg 与 5% 碳酸氢钠 20ml 在 500ml 10% 葡萄糖中配伍, 或 10% 葡萄糖酸钙 10ml 配伍 24h 抗菌效价基本上不变。

(三) 硫酸丁胺卡那霉素与氨茶碱配伍, 抗菌作用明显增强, 但 6h 后作用降低, 且在 8h 后降至 95% 以下。在碱性环境中可能初始 4h 效价升高而 6h 后硫酸丁胺卡那霉素分解而使效价降低, 实验结果提示丁胺卡那霉

素不宜与氨茶碱在输液中配伍使用, 以免产生毒性。

(四) 硫酸丁胺卡那霉素与氨茶碱在 10% 葡萄糖中配伍 4h 后外观色泽变微黄, 与其它药物配伍色泽无显著变化, 且 24hpH 变化不大。

(五) 硫酸丁胺卡那霉素与维生素 C 配伍 4h 后即降至 95%, 因此不宜配伍使用。

参考文献

- [1] 周维书. 丁胺卡那霉素有哪些配伍变化. 药学通报, 1985;20(11):703
- [2] 陈新谦, 金有豫主编. 新编药理学(第 13 版), 1992:79
- [3] 杨建敏等. 一种适用于微生物法测定抗生素血药浓度的新标准曲线. 中国药学杂志, 1992;27(9):540

活性炭对乳酸环丙沙星注射液吸附作用的考察

程 宓 韩福鹏 马晓华

(解放军第 479 医院药械科 丹东 118008)

摘要 在配制乳酸环丙沙星注射液按常规投药量加活性炭时, 活性炭对乳酸环丙沙星有较大的吸附作用, 同时调节不同的 pH 值对其含量也有一定的影响。作者经过反复实验证明活性炭的用量为投药量的 0.02%、pH 值调到 4.00 时乳酸环丙沙星被吸附的量最少。

关键词 乳酸环丙沙星; 活性炭; pH 值吸附作用

环丙沙星(CPFX), 是第三代合成氟喹诺酮类的新型、高效广谱抗菌素, 近年来临床使用范围扩大。我们在配制乳酸环丙沙星注射液的过程中发现, 按常规投药量加 0.03% 的活性炭时, 活性炭对乳酸环丙沙星的含量有

较强的吸附作用, 溶液 pH 值的高低对乳酸环丙沙星的含量也有一定的影响, 同时活性炭对溶液的 pH 值也有不同程度的影响, 为了准确控制活性炭的用量, 我们做了以下实验。

一、仪器与试剂

(一)仪器 UV-2401PC 及 UVPC37 软件(日本岛津)、CX486-66 电脑;pHS-4 型酸度计(杭州亚美电子仪器厂)。

(二)试剂 乳酸环丙沙星(沈阳北方药厂提供 批号:960803 符合中华人民共和国卫生部标准“以下简称部颁标准”);HC-752 型活性炭(杭州木材总厂活性炭分厂,批号 9601-125);0.1mol/L 盐酸、0.2% 乳酸环丙沙星注射液(自制)。

二、实验方法与结果

(一)测定方法 按《部颁标准》乳酸环丙沙星注射液项下含量测定方法进行:

1. 对照品溶液的制备 精密称取在 70℃ 真空减压干燥(以五氧化二磷为干燥剂) 4h 的乳酸环丙沙星对照品适量(约相当于环丙沙星 20mg),置 50ml 容量瓶中,加盐酸(0.1mol/L)溶解并稀释至刻度,摇匀,即得。

表 1 不同量活性炭对乳酸环丙沙星的吸附作用(n=5)

活性炭用量 % (g/ml)	加活性炭前		加活性炭后		△A	△pH	乳酸环丙沙星被吸附的量(mg/100ml)
	A1	pH1	A2	pH2			
0	0.494	4.15	0.494	4.15	0	0	0
0.01	0.494	4.15	0.3872	4.12	0.1068	0.03	50.677
0.02	0.494	4.15	0.4896	4.09	0.0044	0.06	2.088
0.03	0.494	4.15	0.4768	4.08	0.0172	0.07	8.161
0.04	0.494	4.15	0.4694	4.06	0.0246	0.09	11.673
0.05	0.494	4.15	0.4666	4.04	0.0274	0.11	13.001
0.075	0.494	4.15	0.4548	4.04	0.0392	0.11	18.600
0.150	0.494	4.15	0.4472	4.02	0.0468	0.13	22.207
0.225	0.494	4.15	0.4196	3.98	0.0744	0.17	35.303

3. 定量活性炭在不同 pH 值条件下对乳酸环丙沙星含量的影响:按上述贮备液配制方法加投药量 0.03% 的活性炭,配制 pH 值

2. 供试品溶液的制备 精密量取本品 10ml 置 50ml 量瓶中,加盐酸(0.1mol/L)稀释至刻度,摇匀,即得。

精密量取上述对照品溶液及供试品溶液各 1ml 分别置 100ml 量瓶中,加盐酸(0.1mol/L)稀释至刻度,摇匀,照分光光度法(中国药典 1990 版二部附录 74 页)在 277nm 波长处测定吸收度,计算即得。

(二)实验方法

1. 按《部颁标准》,准确称取乳酸环丙沙星适量,加蒸馏水使其溶解,调等渗、调 pH 值,加蒸馏水至 1000ml 摇匀即得含 0.2% 的环丙沙星注射液,定量、测 pH 值后备用。

2. 将上述贮备液分成 9 份,分别按投料量的 0、0.01、0.02、0.03、0.04、0.05、0.075、0.15、0.225% 加入活性炭,搅匀,在 70℃ 水浴上加热 30min 后冷却至 50℃ 抽滤,取滤液冷却至室温后测定含量、pH 值,结果见表 1。

分别为 2.5、3.0、3.5、4.0、4.5、5.0、5.5 的系列溶液,抽滤后分别测定含量和 pH 值,结果见表 2。

表 2 等量活性炭不同 pH 值对乳酸环丙沙星含量及 pH 值的影响(n=3)

pH	加活性炭前		加活性炭后		△A	△pH
	A1	pH1	A2	pH2		
2.50	0.441	2.66	0.393	2.64	0.048	0.02
3.00	0.410	3.04	0.396	2.92	0.014	0.12
3.50	0.461	3.61	0.437	3.43	0.024	0.18
4.00	0.469	3.88	0.448	3.61	0.021	0.27
4.50	0.452	4.47	0.428	4.15	0.024	0.32
5.00	0.471	5.16	0.437	4.73	0.034	0.43

三、讨论

(一)在配制乳酸环丙沙星注射液时活性炭用量的多少对其含量有明显影响,从表 1 的结果来看,随活性炭量的增加(0.02%~0.225%)环丙沙星的含量逐渐减少,且呈线性关系($\gamma=0.99984$),活性炭用量为投药量的 0.02% 时吸附量最小。

(二)从表 2 的结果可知,在定量的活性炭不同 pH 值时,脱炭前后溶液的含量与脱炭后溶液的 pH 值都有相应的变化。在规定

的 pH 值(pH3.5~5.0)范围内,定量活性炭在 pH 值为 4.00 时其吸附量最小。

(三)实验结果证明,在配制乳酸环丙沙星注射液时,应按投药量,调节适当的 pH 值,准确加入活性炭的用量,使其吸附量控制在最低限度,以提高半成品、成品的质检合格率。

参考文献

- [1]中华人民共和国卫生部标准(试行)WS-179(X-154)-93

卡马西平片体外溶出度和兔体内生物利用度的研究

薛佩华 徐铭甫

(上海市第六人民医院药剂科 上海 200233)

摘要 体外溶出度测定结果进口卡马西平片的 T_d 与 T_{50} 平均分别为 89.2min 和 50.0min,国产片的 T_d 与 T_{50} 分别为 25.6min 和 12.4min。进口片与国产片之间的 T_d 与 T_{50} 均有极显著差异($p<0.01$)。兔体内药物动力学测定结果进口片和国产片的 C_m 分别为 6.07 和 9.79 $\mu\text{g}/\text{ml}$, T_m 分别为 2.62 和 3.18h, AUC 分别为 42.35 和 118.8 $\mu\text{g}/\text{ml}\cdot\text{h}$ 。国产片对进口片的相对生物利用度为 357.8%。

关键词 卡马西平片;溶出度;生物利用度;药物动力学

卡马西平片(CBZ 片)为抗癫痫的重要药物之一,也是治疗自发性三叉神经痛的首选药,还可治疗尿崩症及戒除酒精成瘾,应用较广。病人反映服用国产 CBZ 片后,不良反应较进口 CBZ 片大。为此,我们对国产 CBZ 片和进口 CBZ 片进行溶出度和兔体内生物利用度实验。

一、仪器与试剂

UV-2100 可见-紫外分光光度计(日本岛津)。78X-2 型片剂四用测定仪(上海黄海药检仪器厂)IBM PC/XT 计算机(美国 IBM 公司)。CBZ 片,国内某药厂共 5 批(批号 930801、930901、931001、940201、940301)每片含 CBZ 0.1g;国外某药厂共 2 批(批号 008800、491840)每片含 CBZ 0.2g。

试剂:盐酸、乙醇、乙酸乙酯,均为分析醇。

二、溶出度测定

(一)含量测定 依中国药典(1990 版)二部 CBZ 片含量测定项下方法,测定各批 CBZ 片的含量。

(二)溶出度测定 分别取国产 2 片与进口片 1 片,按照中国药典(1990 版)二部 CBZ 片溶出度项下测定方法,但分别于 5, 10, 15, 20, 25, 30, 35, 40, 45, 50 和 60min 在规定取样点取出溶液 10ml(同时补充预热为 $37 \pm 0.5^\circ\text{C}$ 的溶出介质 10ml)依法测定,通过片重校正,计算累积溶出量。

三、生物利用度测定

(一)标准曲线的绘制

精密称取 CBZ 对照品 0.16g,用无水乙