

替硝唑葡萄糖注射液配制中几个问题的探讨

陆粤平(南通医学院第四附属医院, 盐城 224001)

摘要: 目的: 通过对替硝唑葡萄糖注射液配制过程中出现的问题进行研究, 以便找到更好的调配条件。方法: 考察溶液的配制过程中, 加入不同量的活性炭以及加入活性炭顺序的不同对含量的影响。结果: 活性炭对替硝唑含量的吸附随着活性炭量的增加而增加, 而先加入葡萄糖吸附, 所测得的含量比吸附替硝唑葡萄糖所测得的含量高。结论: 通过改进配制过程中的关键问题, 可以提高配制工艺。

关键词: 替硝唑; 活性炭; 含量

中图分类号: R978.61

文献标识码: B

文章编号: 1006-0111(2000)04-0221-02

替硝唑(tinidazole) (1-2-(乙基磺酰基)-乙基-2-甲基-5-硝基咪唑^[1])是继甲硝唑(metronidazole)后研制的硝基咪唑类抗厌氧菌及抗原虫药, 其抗菌活性, 杀菌抑菌效果均优于同系物甲硝唑^[2], 目前已广泛运用于临床中。

根据临床需要, 我院制剂室研制了替硝唑葡萄糖注射液。为了找到较好的调配条件, 本文对硝唑葡萄糖注射液的配制及其一些对含量可能产生影响的因素进行了一系列实验, 现将实验方法和结果介绍如下:

1 仪器与试剂

1.1 仪器 751-GW 分光光度计(上海分析仪器厂); W22-15 数字式自动旋光仪(上海物理分光仪器厂); 全机械加码分析天平。

1.2 试剂 替硝唑(沈阳第一制药厂); 葡萄糖(上海葡萄糖厂); 767 型针用活性炭(上海兴长长活性炭有限公司)。

2 含量测定方法

2.1 替硝唑含量测定 根据卫生部标准, 用紫外分光光度法测定替硝唑含量。精密量取替硝唑葡萄糖溶液 2.0ml, 置 250ml 容量瓶中, 加水稀释至刻度, 摇匀, 照分光光度法, 在 317±1nm 的波长处测定吸收度 A 。按吸收系数 E 为 369^[3] 计算替硝唑含量。

$$\text{计算公式: 替硝唑含量}\% = \frac{G_{\text{测}}}{G_{\text{标}}} \times 100\% =$$

$$\frac{A/EL}{\text{标示量}(g) \times \text{稀释倍数}} \times 100\%$$

2.2 葡萄糖含量的测定 参照《中国药典》1995 年版二部葡萄糖注射液项下含量测定方法测定该样品的旋光度, 乘以 1.0426 得含量。

3 实验方法与结果

3.1 替硝唑葡萄糖溶液的配制条件 称取 0.2g 替硝唑置烧杯中, 加入约配制量 1/10 的水(即 10ml), 边加热边搅拌, 直到替硝唑完全溶解, 观察其溶解时温度及现象。替硝唑在水中极微溶; 当加热水温至 60℃, 替硝唑微溶; 当水温达到 80℃时, 可溶解。

3.2 样品的配制 称取替硝唑 1.3g, 加适量的水加热搅拌使之溶解, 放冷至室温。另称取葡萄糖 35.75g, 加适量的水溶解后, 将两液合并, 并加水稀释到 700ml, 配制成替硝唑葡萄糖溶液备用。称取替硝唑 0.1g, 加适量的水, 加热溶解稀释到 50ml, 配制成替硝唑溶液, 备用。称取葡萄糖 2.75g, 加水溶解并稀释到 50ml, 配制成葡萄糖溶液备用。

3.3 活性炭的吸附作用

3.3.1 不同量的活性炭对替硝唑葡萄糖溶液含量的影响 量取配制好的替硝唑葡萄糖溶液 100ml×6 份, 依次精密加入称定的针用活性炭各 0, 0.02, 0.04, 0.06, 0.08, 0.10g, 60℃保温搅拌 30min, 过滤, 初滤液弃去, 取滤液按“替硝唑

含量测定”和“葡萄糖含量测定”项下操作,分别测其替硝唑和葡萄糖的含量,并折算成相对百分含量。结果见表 1。

3.3.2 活性炭加入顺序对替硝唑吸附的影响

分别量取替硝唑葡萄糖溶液 100ml(以下简称为 A 溶液)与葡萄糖溶液 50ml(以下简称为 B 溶液)。各加入精密称取的活性炭 0.04g, 60℃保温搅拌 30min, A 溶液过滤; B 溶液再加入 50ml 的替硝唑溶液,搅拌后过滤,取两种滤液按“替硝唑含量测定”和“葡萄糖含量测定”项下操作,分别测其替硝唑和葡萄糖含量,并折算成相对百分含量。结果见表 2。

表 1 不同量活性炭对替硝唑的吸附作用

活性炭 (%)	吸收度 (A)	相对标示量 (%)	降低百分量 (%)
0	0.561	99.39	0
0.02	0.556	98.50	0.89
0.04	0.535	94.79	4.60
0.06	0.514	91.06	8.33
0.08	0.491	86.99	12.40
0.10	0.479	84.87	14.52

表 2 活性炭加入顺序对替硝唑吸附的变化

溶液	吸收度 (%)	相对标示量 (%)
A	0.542	96.03
B	0.556	98.51

4 讨论

4.1 配制 0.2% 替硝唑葡萄糖溶液,即将配制量约 1/10 的注射用水加至 80℃,加入配制量的

替硝唑,继续加热并搅拌至替硝唑溶解,将葡萄糖溶于适量注射用水中,加入替硝唑溶液,再加水至全量,即得。

4.2 在配制注射液过程中,加入一定量的活性炭在于提高注射液澄明度和吸附热原,但同时药物也存在吸附作用^[4],尤其是对替硝唑这样在水中溶解度极大、配制浓度低的药物,其吸附作用对药物的含量的影响会更大,从表 1 中可看出,活性炭用量是影响替硝唑含量的主要因素,随着炭量的增加,其吸附力相应增加。

4.3 从表 2 中可看出,加入相同量的活性炭,但加入的顺序不同,先吸附葡萄糖测得的量比直接吸附替硝唑葡萄糖溶液所得的含量要高。

4.4 在实际配制中可以采用按配制量加 0.04% 的活性炭,若要增加活性炭用量,应酌情相应增加替硝唑的投料量。

参考文献:

- [1] 沈特庞,吴建良,计明珠,等. 差示分光光度法测定替硝唑片的含量[J]. 中国医院药学杂志, 1998, 18(1): 35
- [2] 卜家福. 替硝唑注射液的配制及含量测定[J]. 中国药业, 1998, 7(7): 62
- [3] 李力更,王丽萍,封淑华,等. 紫外分光光度法测替硝唑葡萄糖注射液含量[J]. 中国医院药学杂志, 1997, 17(5): 220.
- [4] 李刚,张静,于永洲. 活性炭对乳酸环丙沙星注射液含量的影响[J]. 中国医院药学杂志, 1997, 17(6): 279.

收稿日期: 2000-04-17

卫生部规划教材《药用植物学》(第三版)出版

由第二军医大学药学院郑汉臣教授主编的卫生部规划教材《药用植物学》(第三版),已由人民卫生出版社出版。

本书是根据全国高等医药院校药学专业规划教材审评委员会“关于修订药学专业第四轮教材的几点意见”、本科《药用植物学》教学大纲和各科教材主编会议精神编写的。该书对前版教材作了较多的删改和修正;增补了近年来国内外药用植物研究的新尖内容,充实或介绍了有关药用植物生物技术、生物亲缘关系与化学成分的相关性和分子系统学等基本内容;增加了科的特征性化学成分;改绘了近百幅插图,插印了 31 种重要药用植物彩照,增强了内容的直观性和课程特色。

本书主要读者对象为全国高等医药院校药学专业本、专科师生,亦可用作中药专业或药学专业成人教育或自学教材。该书定价 21 元。上海市翔殷路 800 号(邮编: 200433)翔殷书店有售,联系电话: 021-25075187。