

法(如转篮法、浆法等),由于不能模拟直肠中水份少的情形且水溶性胶壳很快溶于介质中,不能区分不同制剂间药物的溶出速率;而膜法(如透析槽法、渗析袋法)操作不便且有时膜转运成为溶出的主速过程,从而掩盖了药物从基质中溶出的真实特性^[9]。作者自行设计的“转筒膜法”可以模拟直肠水份少,温度稍高于体温、pH 近中性的情形。由于采用孔径较大的微孔滤膜作为扩散界面,在膜面积固定的情况下,药物的转运速率取决于膜两侧的浓度差,因而不会掩盖制剂间的溶出差异,并可根据体内吸收情况调整微孔滤膜的孔径;但该法不能模拟基质与直肠的接触面大及直肠对制剂产生压力的生理状况。

参考文献

[1]陈新谦,金有豫主编. 新编药物学. 第十三版. 北京:

人民卫生出版社,1992:160

[2]British pharmacopoeia commission. British pharmacopoeia 1980 Addendum 1982. first published. London:Her majesty's Stationery Office, 1982:167

[3]陈雪玲,奚念珠,王孝俊等. 吡罗昔康栓的生物药剂学及药物动力学. 中国药理学报,1986;7(6):560~63

[4]田畑博文,岩本洋子,木本一池,他. 药剂学,1987;43(3):141

[5]张玉琥,刘国华,平其能等. 控释咪唑美辛栓剂的溶出度和正常人药代动力学研究. 药科学报,1987;22(8):580~85

[6]阎政,樊启荣,孙长富. 扑热息痛注射液生物利用度研究. 药学情报通讯,1987;2(2):44

[7]于宝成,杜青. 扑热息痛中空栓剂的研制. 中国医药工业杂志,1989;20(10):459

[8]王彦峰,王静,王淑仙. 炎痛昔康栓的生物利用度与药效学. 中国医院药学杂志,1989;9(6):243

[9]杜青,苏德森. 栓剂溶出度的测定方法. 国外医学——制剂分册,1990;21(5):290

酞丁安滴眼液的制备及其稳定性试验

邬惠珍

(上海师范大学新康药厂 上海 200233)

摘要 本文提供了酞丁安滴眼液的改良配方和制备方法并经 8 批样品质量检验和稳定性考察。结果表明,按本文方法生产的酞丁安滴眼液质量稳定,贮存 2 年各项检测指标仍符合药典标准,解决了本品放置易变色、结块等质量问题。

关键词 酞丁安;滴眼剂;稳定性试验

Studies on the preparation and stability test of ocustilla ftibamzoni

Wu Huizhen

(Shanghai Normal University, Shanghai 200433)

ABSTRACT This paper reported a improved recipe and prescription technological process of Ftibamzonum Eye Drops (Ocustilla Ftibamzoni). The examinational results of 8 lots of products showed that the quality is stable and it stores well in 2 years at room temperature.

KEY WORDS Ftibamzonum, Eye Drops, stability test, Ocustilla Ftibamzoni

酞丁安(Ftibamzonum),商品名增光素,为 3-邻苯二甲酰胺基-2-氧代丁醛-1,2-双缩氨基硫脲与二氧六环的包含物。该药作为抗病毒药物多用于配制滴眼液,治疗沙眼等病

毒感染性眼疾。中国药典(一九九〇年版,二部)收载有本品原料药及其制剂酞丁安滴眼液供临床应用,一些厂家也有产品。但是,我们发现酞丁安滴眼液有变色、结块、沉淀等不

稳定现象,直接影响制剂质量和临床疗效。我们在实际工作中,对本品处方、制备工艺等进行研究,较好地解决了该制剂的质量问题。现将有关工作报告如下。

一、材料与方

(一)仪器与试剂 光学显微镜(Olympus-CH,日本);752紫外分光光度仪(上海第三分析仪器厂);pH测定仪。酞丁安、三氯叔丁醇、吐温-80、CMC-Na、EDTA-Na₂、氯化钠等均为国产药用规格。

(二)处方组成 以百分浓度计(%),各成分含量如下:

酞丁安(以无二氧六环、无水纯品计)	0.10
氯化钠	0.85
三氯叔丁醇	0.50
吐温-80	0.10
羧甲基纤维素钠(CMC-Na)	0.40
EDTA-Na ₂	0.01
蒸馏水	加至全量

(三)制备方法 称取羧甲基纤维素钠加入约占全量10%的蒸馏水中,搅拌,放置24hr,过260目尼龙筛;称取酞丁安,加一倍

体积的蒸馏水,再加入等体积的特殊玻璃珠,研磨水飞2~6h,直至全部通过260目尼龙筛;称取三氯叔丁醇,加入约占全量10%的蒸馏水,加热至溶化,再加入处方量的氯化钠和EDTA-Na₂,充分搅拌使溶,混合均匀。将上述三部分配制的溶液合并混匀,于100℃30分钟灭菌,在无菌环境中加入吐温-80,再加蒸馏水至全量,充分混匀,过260目尼龙筛,分装灌封,即得。

(四)质量检验 按中国药典(一九九〇年版,二部)第604页“酞丁安滴眼液”项下规定测定其pH值、主药酞丁安的含量,一共检查8个批号。另在显微镜下观察,用此法配制的滴眼液,混悬于液体中的酞丁安的粒度。

(五)稳定性考察 为考察按本处方及配制方法生产的酞丁安滴眼液的稳定性,对8批样品进行室温下自然放置2年的稳定性试验,考察其外观色泽、颗粒大小、pH值和主药含量等变化情况。

二、结果

按上述组方、制备方法配制的成品,经质量检验和稳定性考察,结果见附表。

附表 酞丁安滴眼液质量检验与稳定性试验结果

批号	配制后即时检测结果				检测日期	室温自然放置后检测结果			
	含量(%)	pH值	颗粒(μm)	颜色		含量(%)	pH值	颗粒(μm)	颜色
* 900228	105.1	4.8	<5	淡黄	93.1	90.0	3.8	<5	淡黄
910128	91.5	4.6	<5	淡黄	93.1	90.2	4.7	<5	淡黄
910205	101.3	4.8	<5	淡黄	93.1	102.0	4.8	<5	淡黄
910524	106.0	4.8	<5	淡黄	93.5	105.0	4.8	<5	淡黄
910828	103.8	4.8	<5	淡黄	93.8	102.4	4.7	<5	淡黄
911017	99.7	4.9	<5	淡黄	93.10	99.0	4.9	<5	淡黄
920115	101.6	5.0	<5	淡黄	94.1	100.4	5.0	<5	淡黄
920207	103.4	4.9	<5	淡黄	94.1	101.2	5.0	<5	淡黄

* 900228批号样品自然放置至93.1检测,pH值下降至3.8,超过规定范围。

三、讨论

(一)用本文筛选的处方和制备工艺生产的酞丁安滴眼液8批样品检验结果均符合药典规定。pH值在4.6~5.0,主药含量为标示量的91.5~106.0%,均在规定的范围之内;外

观淡黄色,混悬液中微粒粒度<5μm,制剂质量合格;稳定性试验结果:8批样品,室温自然放置时间达2年或2年以上,其中有7批样品检测各项指标均符合规定,色泽稳定,微粒粒度<5μm,无结块现象,pH值和含量仍

在规定范围之内;另有 900228 批号样品,已放置 2 年零 10 个月,检测其 pH 值下降较多,已在规定范围之外,其他各项指标仍符合规定。由此实验结果提示,用本文处方及配制方法生产的酞丁安滴眼液的质量和稳定性都很好,至少可保存 2 年。

(二)我们在工作中体会到,提高酞丁安滴眼液质量的关键是酞丁安粉末在滴眼液中混悬的稳定性。粉碎后的微粒直径必须在 $5\mu\text{m}$ 以下,混悬液才稳定,药物也才能穿过角膜和结膜,发挥疗效。对药物的微粉化处理,可以用气流粉碎机,但这种粉碎方法消耗

大,且细粉粒度不匀,污染环境影响操作人员健康。我们用湿法玻璃珠砂磨水飞,可以克服上述缺点,加上处方中应用 CMC-Na 和吐温-80,可使滴眼剂的混悬体系更加稳定。

参考文献

- [1]中华人民共和国药典. 一九九〇年版. 二部. 北京:人民卫生出版社,1990:604
 [2]黄雨荪. 利福平在眼科的临床应用. 新药与临床, 1985;4(2):107
 [3]严明标等. 酞丁安对单纯疱疹病毒 I 型的 DNA 和蛋白质合成的抑制作用. 中华医学杂志, 1985;65(10): 587

地塞米松磷酸钠注射液和维生素 B₆ 注射液的配伍稳定性

孙成春 陈冬梅* 王景祥

(济南军区总医院药理科 济南 250031)

摘要 地塞米松磷酸钠注射液与维生素 B₆ 注射液在 5% 葡萄糖注射液中配伍后 6h 内,外观、pH 值、薄层 R_f 值及含量测定均无显著变化;薄层层析实验证明二者在 5% 葡萄糖中配伍可行。

关键词 地塞米松磷酸钠注射液;维生素 B₆ 注射液;配伍稳定性

Compatible stability of injection dexamethasone sodium phosphate and injection vitamin B₆

Sun Chengchun, Chen Dongmei, Wang Jingxiang

(General Hospital of Jinan Military, Jinan, 250031)

ABSTRACT Compatible stability of injection Dexamethasone Sodium Phosphate and injection Vitamin B₆ in 5% glucose injection were observed. The results showed that there were no significant changes in outward, pH and R_f in 6h after they had been mixed. Ultraviolet spectrophotometry was used to detect the content of Dexamethasone Sodium Phosphate. The results showed there were no significant changes. It has proved that the two drugs were compatible.

KEY WORDS injection dexamethasone sodium phosphate, injection Vitamin B₆, compatible stability

* 中国药科大学实习生