

匹罗卡品脂质体滴眼剂包裹率测定实验研究

张建华 刘荣春 曹东亚 孙红品

(解放军第 145 医院 莱阳 265200)

摘要 透析法是除去脂质体未包封药物的最简单和常用的方法,经采用透析法对匹罗卡品脂质体滴眼剂进行包裹率测定。根据实验测得包裹率及变异系数分别为 36.3%,0.46%,该方法操作简单,结果准确。

关键词 匹罗卡品;脂质体;包裹率

脂质体制剂的包裹率测定是检验其质量的重要环节。我们通过透析法,测定了匹罗卡品脂质体滴眼剂的包裹率,取得了满意的效果。其方法如下:

一、材料与方法

(一)设备及材料

紫外可见分光光度计(WFZ800-D₂型、北京第二光学仪器厂);磁力搅拌器(上海医疗器械厂);透析膜(德国产、莱阳生化制药厂提供);匹罗卡品脂质体滴眼剂(本院制剂室生产,批号 961012)。

(二)测定方法

对照品溶液的制备:精密称取 105℃干燥至恒重的硝酸毛果芸香碱 0.1g,置 100ml 量瓶中,加磷酸钠盐缓冲液溶解并稀释至刻度,摇匀。精取 5ml,置透析袋内封口,放入三角烧瓶中。精密加入磷酸钠盐缓冲液 45ml 浸泡、用磁力搅拌器每隔 2h 搅拌 15min。12h 后,精取浸泡液 1ml,置 100ml 量瓶中,加蒸馏水稀释至刻度,摇匀,即得。

供试品溶液的制备:精取匹罗卡品脂质体滴眼剂 5ml,置透析袋内封口,放入三角烧瓶中。精密加入磷酸钠盐缓冲液 45ml 浸泡,用磁力搅拌器每隔 2h 搅拌 15min,12h 后精取浸泡液 1ml,置 100ml 量瓶中。加蒸馏水稀释至刻度摇匀,即得。

取对照品溶液与供试品溶液,以蒸馏水为空白,按分光光度测定匹罗卡品法,在 207nm 处分别测定其吸收度^[1]。

二、结果

经在相同条件下对对照品与供试品溶液的测定,对照品溶液平均回收率为 99.62%,变异系数 0.19%。供试品溶液的平均回收率为 63.7%,变异系数 46%。采用包裹率计算公式。

$$\text{包裹率}\% = \frac{C_{\text{总}} - C_{\text{游离}}}{C_{\text{总}}} \times 100\%$$

$C_{\text{总}}$:脂质体混悬液中总药量。 $C_{\text{游离}}$:未包入脂质体中药物量^[2]。计算结果表明匹罗卡品脂质体滴眼剂的平均包裹率为 36.3%,变异系数为 0.46%,其结果见下表:

表 1 匹罗卡品对照品与供试品回收率测定结果

序号	对 照 品			供 试 品		
	投入量 g/100ml	测得量 g/100ml	回收率 (%)	投入量 g/100ml	测得量 g/100ml	回收率 (%)
1	1.0062	1.0017	99.55	1.0116	0.6474	63.99
2	1.0103	1.0086	99.83	1.0116	0.6413	63.40
3	1.0024	0.9971	99.47	1.0116	0.6444	63.70
平均回收率(%)		99.62		63.70		
RSD(%)		0.19		0.46		

三、讨论

脂质体滴眼剂作为一种新剂型在质量检测方面少有报道。我们通过透析法进行匹罗卡品脂质体滴眼剂的包裹率测定取得了较为满意的效果。因为透析法是除去未包封药物的一种最简单和最常用的方法。它能除去几乎所有游离药物^[3]。在透析过程中应注意透析液的渗透强度与匹罗卡品脂质体滴眼剂的渗透强度应基本相同,否则会引起脂质体体积发生变化,导致被包封的药物泄漏。透析液用磷酸盐缓冲液来维持渗透压及 pH 可起

到防止脂质体破坏的目的。定时搅拌达到药物充分扩散。在测定过程中设立对照品溶液,可在相同条件下进行对照比较,了解透析是否完全。该方法测定简单,结果准确。

参考文献

- [1] 济南军区后勤部. 医院制剂操作技术, 第1版, 山东: 科学技术出版社, 1992:401
- [2] 刘国杰等. 药剂学, 第2版, 北京: 人民卫生出版社, 1985:996
- [3] 袁继民等. 现代药物制剂技术, 山东: 济南出版社, 1992:279

头孢菌素类药物在静脉输液中的稳定性及与部分药物配伍

邢山岗 袁荣刚 宋立红

(解放军第210医院药剂科 大连 116021)

近年来,头孢菌素类抗生素作为一类强有力的抗细菌感染药物,已被临床广泛应用,适用于许多单纯或混合感染。但因其化学结构类似青霉素,母核均含有不稳定的 β -内酰胺环,易水解,其水溶液的不稳定性,放置时间越长则分解越多,不仅药效消失,而且产生的致敏物质也增多,因此了解其在临床常用输液及配伍中的稳定性,显得十分重要,为了保证临床用药的安全有效,减少不良反应,我们查阅近几年有关文献综述如下。

头孢唑啉钠 为第一代头孢菌素,是临床应用最多的一种。谢玉芝^[1]考察头孢唑啉钠在5%葡萄糖和5%葡萄糖盐水注射液,生理盐水中不避光条件下,24h内浓度下降均低于3%。李焕德^[2]等报道5个厂家头孢唑啉钠在药典规定的葡萄糖注射液 pH(3.2~5.5)范围内,溶解于10%葡萄糖注射液中,放置24h内不同时间的光谱分析3h内主峰含量几乎不变。在3h后色谱条件不变的情况下,可见有3个色谱峰出现,但结果按归一化测定含量,5个厂家产品在各pH值时不同

时间所测结果均在98%以上。头孢唑啉钠^[3]与利巴韦林注射液在生理盐水中混合后,25℃~30℃以下,4h内外观无任何变化。但测定两药含量均降低24%以上,两药不宜混合静滴。

头孢他定(CA2) 商品名为复达欣,为第一代头孢菌素,注射剂中加有一定量的无水碳酸钠,因此CA2遇碳酸氢钠不稳定。周延安等^[4]对不同温度下(10℃,24℃,37℃)CA2分别与0.9%氯化钠注射液,平衡液,0.5%甲硝唑注射液按临床常用配伍,结果表明在8h内均有足够的稳定性。但与碳酸氢钠注射液配伍时37℃6h可保留80.63%,4h内保留近90%。在室温^[5]20℃~30℃下对在10%葡萄糖低分子右旋糖酐注射液中6h内测定其含量>97%。

头孢噻肟钠 为第三代头孢菌素,张毕奎^[6]对5个厂家头孢噻肟钠在不同pH值10%葡萄糖注射液中放置24h后,经HPLC测定含量均在98%以上,pH5.0的葡萄糖注射液中溶解最快。在10%葡萄糖注射液^[7]中