

# 诺氟沙星葡萄糖注射液的研制

蒋尧生 (湖南省双牌县人民医院, 双牌 425200)

诺氟沙星是第三代氟喹诺酮类抗菌药物, 具有广谱、高效特点, 临床上多使用片剂和胶囊剂, 为提高其血药浓度, 增强其疗效以及扩展治疗应用范围, 我们配制了诺氟沙星葡萄糖注射液, 现报告如下:

## 1 配制方法

1.1 处方: 诺氟沙星1.6 g 葡萄糖50 g 冰醋酸适量

(1 mol/L) EDTA-2Na 0.025g 注射用水加至1000 ml。

## 1.2 制备

1.2.1 取葡萄糖加热注射用水配成50%的浓溶液, 用1 mol/L HCl调节pH值, 加入0.15%针用炭煮沸30 min, 冷至60°C脱炭, 加入EDTA-2Na, 搅溶搅匀。

1.2.2 取1 mol/L冰醋酸溶液加入诺氟沙星使溶解,加入注射用水及针用炭适量搅拌15 min脱炭。

1.2.3 将上述两液合并,加注射用水使成1000 ml,搅匀经pH、含量测定合格后,灌封成250 ml/瓶,用115°C热压灭菌30 min即得。

## 2 质量控制:

2.1 规格标准:250 ml;0.4 g,本品含诺氟沙星( $C_{16}H_{15}FN_3O_3$ )应为标示量的90.00—110.00%;含葡萄糖( $C_6H_{12}O_6 \cdot H_2O$ )应为标示量的95.0—105.0%<sup>[1]</sup>

2.2 本品为微黄绿色澄明液体

2.3 鉴别:诺氟沙星,照中国药典(1990版二部)诺氟沙星项下的鉴别方法检查。葡萄糖,照中国药典(1990版二部)葡萄糖项下鉴别方法检查。

2.4 检查:pH值应为4.0—5.0。不溶性微粒:取本品依法检查。溶液的颜色:本品与黄绿色4号标准比色液比较不得更深。热原:取本品依法检查,剂量按家兔体重每1 kg注射24 mg应符合规定。其它:应符合注射剂项下有关的各项规定。

## 2.5 含量测定

2.5.1 诺氟沙星:精密吸取本品5 ml置100 ml容量瓶中,加pH 7.4磷酸盐缓冲液至刻度,摇匀;精密吸取上液5 ml置100 ml容量瓶中,加pH 7.4磷

酸盐缓冲液至刻度,摇匀,按分光光度法(中国药典1990年版二部附录24页)在272 nm的波长处测定吸收度,按 $C_{16}H_{15}FN_3O_3$ 吸收系数( $E_{1\%}^{1\text{cm}}$ )为1180计算,即得<sup>[3]</sup>。

2.5.2 葡萄糖:取本品适量依法测定旋光度(中国药典1990年版二部附录17页),与1.0426相乘,即得供试品中含有 $C_6H_{12}O_6 \cdot H_2O$ 的重量(g)。

2.6 室温留样考察:将制备的诺氟沙星葡萄糖注射液20瓶,置留样橱中室温贮存,分别于1, 30, 60, 90, 120 d观察药液外观,pH值并测定诺氟沙星含量,结果药液贮存120 d内,测定其含量分别为:101.00, 100.34, 100.00, 99.52, 99.21%。溶液的颜色,澄明度,pH值均无明显变化。

## 3 讨论:

3.1 溶解诺氟沙星的冰醋酸溶液宜用1 mol/L,并于冷后再加入诺氟沙星溶解为妥,以免溶解时反应剧烈而引发副反应。

3.2 诺氟沙星对 $Fe^{+++}$ 极为敏感,微量 $Fe^{+++}$ 即可使产品呈棕黄色而不合格,所以在加入诺氟沙星液之前,应于葡萄糖液中加入0.002—0.003%(总液量)的EDTA-2Na用以络合 $Fe^{+++}$ ,以保证产品质量。