

盐酸洛美沙星注射液配制工艺的改进

赵文银(阿克苏 843000 新疆阿克苏地区中心制剂室)

洛美沙星由日本北陆制药公司研制^[1],是第3代喹诺酮类强效广谱杀菌剂^[2]。因此,我室开发生产了盐酸洛美沙星注射液,但按常规配制,活性炭对洛美沙星有强吸附性,所以要增加投料量,提高了成本,且含量不稳定,易形成梯度分布,影响其质量。

1 活性炭对盐酸洛美沙星时吸附实验

1.1 实验材料

T530G 型分光光度计(惠普上海分析仪器有限公司),盐酸洛美沙星(江苏常州第二制药厂,批号:H000208),活性炭(杭州木材总厂活性炭分厂,批号:961206),自制注射用水。

1.2 方法

1.2.1 样品配制 称取 1g 盐酸洛美沙星,加注射用水至 500ml,得盐酸洛美沙星溶液。

1.2.2 实验步骤 分别取 50ml 溶液至容量瓶中,分别加活性炭 0.01, 0.025, 0.05, 0.10 和 0.20g 至量瓶中,摇匀,在 50℃ 水浴 30min, 过滤, 取续滤液, 在 287.5nm 处测定吸收度 A, 得其吸附量, 结果见表 1。

活性炭/%	吸收度	相对含量/%	吸附量/%
0.00	0.508	103.3	0.00
0.02	0.487	99.0	4.10
0.05	0.465	94.6	8.40
0.10	0.424	86.3	16.4
0.20	0.355	72.3	30.0

1.3 结果和讨论

0.005% 活性炭对盐酸洛美沙星的吸附量达 8.

4%, 而 0.1% 活性炭吸附量 16.4%。其因是盐酸洛美沙星结构似生物碱, 且是强酸弱碱盐, 显酸性, pH3.6 左右, 而活性炭在 pH3~5 之间, 吸附量最大, 故活性炭对盐酸洛美沙星有强吸附性, 对盐酸洛美沙星注射性有较大的影响, 需改进配制工艺。

2 制备工艺

取适量注射用水, 加入适量葡萄糖, 搅拌溶解, 按 0.05% 耐活性炭加入, 搅拌 15min, 加入一定量的 EDTA-2Na, 搅拌使溶, 再添加注射用水至配制量, 测葡萄糖的含量, 使符合规定, 过滤脱炭, 投入盐酸洛美沙星, 搅拌溶解, 调 pH4.0~5.5, 测定 pH 值, 并使其含量符合规定, 过滤分装, 热压 115℃30min 灭菌。

3 结果

我室生产 3 批次 300 瓶盐酸洛美沙星注射液, 但菌内毒素检查符合规定, 用于临床, 无一例输液反应。

4 讨论

经光脱炭, 避免了活性炭对盐酸洛美沙星的吸附, 故几乎可按理论量投料, 这样降低了成本, 且含量均稳定, 不会形成梯度分布, 保证了质量, 我室参照《卫生部药品标准》检查各项, 均符合规定。

参考文献

- 1 中国药学杂志编辑部. 新药手册, 第二版. 天津: 天津科学技术出版社, 1998: 34.
- 2 赵旺盛, 杨鹏云, 戴传箴, 等. 洛美沙星体外抗菌活性测定. 中国医院药学杂志, 1994, 3(14): 126.