

复方雷锁辛搽剂稳定性观察和合理处方的选择

钟钰 (杭州市第三人民医院药剂科, 杭州 310009)

复方雷锁辛搽剂主要成分为雷锁辛(间苯二酚)和苯酚, 同属易氧化变色的酚类物质。在原有处方条件下, 极易氧化变色, 使药效降低, 颜色变深。对此, 本方通过复雷搽剂的颜色变化来观察温度、pH值、空气、金属离子等因素对本搽剂的稳定性影响。

1 实验材料

1.1 雷锁辛、药用、批号900911、江苏年沙化工厂

1.2 苯酚、AR级、批号900804、杭州双林化工试剂厂

1.3 焦亚硫酸钠、AR级、批号891105、永嘉县化工试剂厂

1.4 EDTA-2Na、AR级、批号891208、长春化学试剂厂

2 处方及制备

2.1 处方

雷锁辛 100.0 g 苯酚 20.0 g 丙酮 50.0 ml
乙醇(95%) 100.0 ml 蒸馏水 加至1000.0 ml

2.2 制备: 称取处方量的雷锁辛和苯酚, 溶于丙酮和乙醇中, 最后加蒸馏水至量。

3 实验方法及合理处方选择

实验不同处方设计表

处方 1	处方 2	处方 3
原处方	处方 1	处方 2
	+ 焦亚硫酸钠	+ EDTA-2Na
		+ 稀HCl调pH4-5

按上述三种不同处方配制复雷搽剂, 分别于 $5 \pm 2^\circ\text{C}$ 、 $25 \pm 2^\circ\text{C}$ 、 $35 \pm 2^\circ\text{C}$ 温度条件下放置 3 个月, 随时记录颜色变化情况, 结果见表:

复雷搽剂颜色变化情况表

温度 $^\circ\text{C}$	处 方	时 间 (天)					
		1	2	4		15	90
$5 \pm 2^\circ\text{C}$	处方 1	无 色	无 色	无 色		黄 色	棕黄色
	处方 2	无 色	无 色	无 色		微黄色	黄 色
	处方 3	无 色	无 色	无 色		无 色	无 色
$25 \pm 2^\circ\text{C}$	处方 1	无 色	微黄色	黄 色		棕黄色	棕黄色
	处方 2	无 色	无 色	无 色		微黄色	黄 色
	处方 3	无 色	无 色	无 色		无 色	无 色
$35 \pm 2^\circ\text{C}$	处方 1	微黄色	黄 色	棕黄色		棕黄色	棕黄色
	处方 2	无 色	微黄色	微黄色		黄 色	棕黄色
	处方 3	无 色	无 色	无 色		无 色	无 色

4 结论: 实验结果表明, 用处方 3 制备的复雷搽剂稳定性最佳, 改进后处方为:

雷锁辛 100.0 g 苯酚 20.0 g 丙酮 50.0 ml
焦亚硫酸钠 1 g EDTA-2Na 0.4 g 稀 HCl
1.5 ml 乙醇(95%) 100 ml 蒸馏水 加至1000.0

ml

该处方经本院皮肤科临床应用三年来, 稳定性好, 受到广大医师和患者的好评, 现已成为我院皮肤科的一个特色制剂。

5 讨论

温度：温度增加，氧化反应的速度加快，氧在水中的溶解度降低，药物的自氧化速度也有所降低，为此，本文设计三个不同温度对复雷搽剂进行观察。

pH 调整剂：酚类结构的氧化还原势决定于溶

液的 pH 值，对于易氧化破坏的酚类药物，须调节 pH 于酸性范围。

金属离子螯合剂：金属离子可以促使自氧化反应的进行，是药物氧化反应的催化剂，故本文采用 EDTA-2Na 可有效减缓氧化过程。