

氧氟沙星滴眼液的配制、质量控制及应用

崔丽霞(英德 513000 广东英德市人民医院)

氧氟沙星是一种新型的全合成氟喹诺酮类广谱高效抗菌药,由于具有抗菌谱广,抗菌活性强的特点,对革兰氏阳性菌,阴性菌群均有较强的抗菌作用,且与其它抗菌药未见交叉耐药性,目前内各厂家已对氧氟沙星进行大力开发。因氧氟沙星在眼科应用良好,现将本院制剂氧氟沙星滴眼液的配制、质量控制及应用报道如下。

1 处方与制备工艺

1.1 处方

氧氟沙星 3g,氯化钠 8.5g,羟苯乙酯 0.3g,醋酸适量,氢氧化钠溶液(1mol/L)适量,注射用水加至 1 000ml。

1.2 制备

取氧氟沙星,加注射用水约 200ml,滴加醋酸搅拌使恰溶。另取羟苯乙酯,用适量热注射用水溶解加入氯化钠使溶解。将上述两液混合搅匀,用氢氧化钠溶液(1mol/L)调 pH 值后加水至 1 000ml,摇匀,用 0.6 μ m 滤膜过滤,于 100 $\times$ C 30min 流通蒸汽灭菌,无菌分装即得。

2 质量控制

2.1 性状

应为淡黄色澄清液体。

2.2 鉴别

2.2.1 取本品少许,滴加氢氧化钠试液,淡黄色渐消

中国现代应用药学杂志 1999 年第 16 卷第 7 期

退,再滴加稀盐酸,淡黄色又出现。

2.2.2 取本品 0.5ml 加三氯化铁试液 1 滴显橙红色。

2.2.3 本品显钠盐和氯化物的鉴别反应。

2.2.4 pH 值:应为 6.0~7.0。

2.2.5 含量测定:氧氟沙星对照品溶液的制备:精密称取经 105℃ 干燥至恒重的氧氟沙星对照品 30g 置 50ml 量瓶中,加盐酸液(0.1mol/L)溶解并稀释至刻度,摇匀。精密量取上液 1ml,置 100ml 量瓶中,加盐酸液(0.1mol/L)至刻度,摇匀,即得。

供试品溶液的制备:精密量取本品 5ml,置 50ml 量瓶中,加盐酸液(0.1mol/L)置刻度,摇匀,精密量取稀释液 1ml,置 50ml 量瓶中,加盐酸液(0.1mol/L)至刻度,摇匀,即得。

测定法:以盐酸液(0.1mol/L)为空白,取对照品溶液与供试品溶液照分光光度法分别在 293nm 处测定吸收度,计算,即得。

3 刺激性实验

取健康家兔 4 只,体重 1.5~2.0kg,先右眼滴入

1gtt 配氧氟沙星眼水,左眼滴入生理盐水作对照。滴药后 30min,45min,1h,24h 观察,有无角膜充血水肿,溃疡和混浊等。结果双眼无明显差异,滴眼液对眼无刺激性。

4 临床应用

用于治疗细菌性眼睑炎,麦粒肿,泪囊炎,各种沙眼,结膜炎,角膜炎,巩膜炎,急性新生儿滤泡性结膜炎。创伤及术后感染等多种疾病。

5 讨论

5.1 处方中醋酸主要起增溶作用,并使氧氟沙星保持原有的抗菌活性。用氢氧化钠调节 pH 值是为了减少对眼的刺激性。实验结果表明,处方合理,质量符合要求。

5.2 采用紫外分光光度法测定氧氟沙星制剂中的辅料对主药的测定无干扰,方法简便易行。

5.3 本院制剂氧氟沙星滴眼液约 6 000 瓶经本院临床应用 2 年,经信息反馈,疗效确实,深受患者及医师欢迎。