

如将样品液放于冰箱中(4℃),经48小时,仅5~6%水解。降解产物NE仍可与EE同时测定,注意与NEAC测定分开。测得的NE量与测得的NEAC量通过换算就可得出NEAC溶解的总量。

结论

以上讨论可认为:虽然0.02%SLS的0.1MHC1液可作为水溶性低的制剂较好的溶出介质,但水仍为一种较好的介质。如果不能

用水醇介质,可用0.1MHC1:0.02%SLS作为溶出介质配成600ml溶液,用U.S.P.转篮法以100转/分的转速适于所有受试样品。NEAc在酸性介质中水解的NE量可测出并可用于校正溶出NEAc的总量。当用酸性介质时,为延长HPLC分析仪中分析柱的使用寿命,应加入缓冲液流动相。

[J.Pharm.Sci《药学科学杂志》76(2):163,1990(英文)]

硫氮萘酮在乙基化β—环糊精复合物中的溶出特性

卞俊译 周全校

作者曾扼要地报道过硫氮萘酮的疏水性,β—环糊精衍生物的复合物一种水溶性钙拮抗剂压制片的溶出速率。给大白鼠口服乙基化β—环糊精复合物,显示了较长持续的溶出作用。本文对硫氮萘酮的溶出作用的各种环境影响作了详细的研究,弄清了乙基化β—环糊精复合物的释放机理。

实验部分

固体复合物的制备:将盐酸硫氮萘酮与β—环糊精按1:1M混合,用揉搓法制成固体复合物。用银量法测定其确为盐酸盐。该复合物经α线衍射法,证明它的衍射类型明显地与物理混合物的衍射类型不同。

片剂的释放试验:样品粉末26克(<100目)。含硫氮萘酮6克及稀释剂或其它等量的复合物,在1000Kg/cm²的压力下压成圆柱片(直径4mm)。用转篮法(转速为36,60或91转/分,测定出药的溶出速率。溶出介质,第一液为pH1.2,第二液为pH6.8(JPX1)或0.05M醋酸钠缓冲溶液(pH4.0),温度37℃。经分光光度计在245nm处测定。

片剂表面的观察:药片表面在溶出试验前后用扫描电子显微镜观察。样品在室温下

干燥二天,根据直流Sputter技术用金包衣。

水的穿透性试验:用仪器测定了水的穿透性,结果与L.S.C.Wan等人报道的一样,但有较高的重现性。水的摄入量根据标定毛细管测得。复测3次,均低于平均值10%以下。

体内吸收试验:4条雄性狗,体重13~15公斤,给药前禁食24小时。口服给药30mg(含稀释剂:淀粉,或其二乙基—β—环糊精复合物,测定前,每次抽取3ml血液样品以3.8%枸橼酸钠作抗凝剂,用HPLC测定血浆中硫氮萘酮。

结果和讨论

硫氮萘酮从乙基化β—环糊精复合物中的释放特性:结果表明淀粉混合物的释放速率很快,因为这种药物有高度的水溶性。而复合物中药物的释放很慢,(三乙基—β—环糊精复合物<二乙基—β—环糊精复合物),这取决于相应的乙基化β—环糊精的水溶性在各种溶出介质中测定。这种释放特性是由于结构复杂性,三乙基—β—环糊精>>二乙基—β—环糊精而释放明显受到抑制,并且几乎不受介质pH的影响。

另外,转篮的速度对药片中主药的释放

速率也有影响。36~91rpm时, 释放速率基本恒定。

加入高浓度(0.5%W/V)表面活性剂, 溶出速度稍有增加。这可能是因为该复合物被增溶及片剂表面的亲湿性加强所致。

体内吸收特性: 狗的试验结果表明, 硫氮草酮吸收迅速, 血浆生物半衰期短, 其达

峰时间(t_{max})平均停留时间(MRT)和变异停留时间值都延长。另外, AUC没有明显下降。这些资料提示乙基化 β -环糊精作为硫氮草酮的延缓释放性载体是有效的。

[J Pharm Sci. 《药学科学杂志》79(2) 128.1990. (英文)]

应用工业型平板式超滤机制备大输液的初步研究

空军兰州医院药剂科 郑志安 周嘉秀 魏晓龙 魏多详* 张环*

本文以临床常用的四种葡萄糖注射液为例, 报道了应用UF—J工业型平板式超滤机制备大输液的新工艺。通过对超滤后葡萄糖注射液的含量、5-HMF、微粒的测定和热源细菌的检查, 证明用超滤机制备大输液, 可提高过滤速度和产品的质量。

仪器与材料

UF—J工业型平板式超滤机(空军兰州医院研制); 6种型号(2F—82、30—82、30、PAN₁、PAN₂)的超滤膜(空军兰州医院研制); WXG—6自动旋光仪(上海光学分析仪器修理厂); WZS—1折光仪(上海分析仪器厂); 751分光光度计(上海分析仪器厂); ZWF—4A型注射液微粒分析仪(空军天津医院); 鲎试剂及内毒素工作品(福建省药品检验所批号: 891225); 葡萄糖注射原料粉。

方 法

1. 超滤膜的安装

为了考察膜的性能, 在同一台超滤机上安装了上述6种型号的超滤膜, 将其与6对分支管道接通, 以便分别收集通过各号膜的超滤液(简称超后液)。

2. 超滤机的处理

为验证除菌和除热原作用, 事先将超滤机用3%Na₂CO₃溶液冲洗, 将碱液冲净后再以1~3%双氧水冲洗灭菌、存放, 临时时再以注射用水冲洗。

3. 输液瓶的准备

将输液瓶按常规清洗后, 盖薄膜、胶塞、铝盖封口, 高压灭菌后备用。

4. 原浓液的制备

称取葡萄糖原料适量, 按标示浓度50、25、10、5(%) , 制备成各10万ml的溶液, 不加活性炭, 以折光法测定中间品含量即称原浓液。

5. 超滤

(1)初滤: 将原浓液先经砂滤棒初滤, 再泵入超滤机主管道循环、混匀后取出部分作为超前液以与超后液进行含量、热源、细菌比较。

(2)收集: 为防止分支管道残留水分稀释超后液, 将开始收集的1万ml另置; 然后分别收集经各号膜滤出的超滤液一式四份。1份经高压灭菌测定含量、微粒及5-HMF; 另三份是按每30分钟收集一份, 不灭菌, 直接检查细菌和热原。

结 果

*兰州医学院90年毕业实习生