

氧氟沙星外用制剂的开发与应用

王中予(解放军第 161 医院 武汉 430010)

摘要 目的:综述氧氟沙星外用制剂的研制与应用。方法:广泛查阅氧氟沙星外用制剂的研制和临床应用资料。结果与结论:氧氟沙星已被制成各种剂型,并广泛应用于临床。

关键词 氧氟沙星;外用制剂;临床应用

氧氟沙星对革兰阳性菌、阴性菌和部分厌氧菌均有良好的抗菌作用,临床上已广泛应用,过去氧氟沙星剂型单一,不良反应较多。近几年医务工作者结合临床需要研制了多种外用剂型,直接作用于局部,较好的解决了药物的首过效应、生物利用度等问题。现简介如下:

1 治疗泌尿生殖系感染的制剂

氧氟沙星对单纯性淋病的治愈率为 98%,但口服氧氟沙星治疗淋菌性宫颈炎往往难以治愈。卫祥云等^[1]采用甲基纤维素和羟甲基纤维素纳为成膜材料,研制出氧氟沙星膜剂。用该膜直接粘附炎症部位,在局部形成较高药物浓度,作用强而持久,治疗效果明显高于口服制剂。孙国明等^[2]则将氧氟沙星制成涂剂,用二甲基亚枫促进药物溶解并能使药物易于渗入皮肤深层,从而达到消炎、止痛效果,加入甘油即可减少主药的刺激性,又可延长药物的滞留作用,该涂剂适用于治疗因葡萄球菌、链球菌、淋球菌感染引起的炎症。

2 治疗皮肤疾患的制剂

庄志铨等^[3]应用微生物纸片法测定了不同基质氧氟沙星软膏的抑菌作用,从而确定了以聚乙二醇 4 000 与聚乙二醇 400 为基质的氧氟沙星软膏,具有局部浓度高,作用持久,用药次数少等优点。靳培英等^[4]用 0.5% 氧氟沙星凝胶剂治疗 119 例化脓性皮肤病包括毛囊炎、脓疱病等,结果表明治愈率 100%。具有不污染衣服,无滑腻感等优点。

3 治疗牙周疾病的制剂

杨继章等^[5]采用 PVA-1778、CMC-Na 等成膜材料,同时在膜材中加入强的松、达克罗

宁、月桂氮卓酮等物质制成口腔溃疡膜,临床使用有效率 97.9%。王震等^[6]也是用 PVA-0486、CMC-Na 为成膜材料研制出氧氟沙星复合膜剂,利用缓释口腔膜的原理,制成复盖膜粘附于药膜上,使药膜表面不直接与口腔涎液完全接触,具单向释药作用,从而提高了疗效。Yamagami 等^[7]将氧氟沙星制成一种水溶性控释植入剂,将其放在牙周炎病人的牙周袋内,每周 1 次,连用 4 周。研究发现用药部位的各项指标均有显著改善。

4 耳用制剂

目前确认氧氟沙星对慢性化脓性中耳炎有较好的效果。董学文^[8]用氧氟沙星和强的松联合配制成滴耳油治疗急、慢性中耳炎患者 125 例,有效率为 98.4%。针对临床采用滴耳液易流失、作用不持久等缺点,胡容峰等^[9]以 PED-400、PEG-6 000 为基质制成氧氟沙星滴丸,该滴丸临床用于治疗与绿脓杆菌有关的中耳炎有很好的疗效。

5 眼用制剂

朱伟燕^[10]报道将氧氟沙星加入硼酸、硼砂、枸橼酸钠、亚硫酸钠等物质中制成滴眼液,用于治疗急、慢性结膜炎、角膜炎、泪囊炎,效果良好,有效率为 95%。周静圣等^[11]给家兔和人的下眼睑结膜囊内一次性涂入 0.3% 氧氟沙星眼膏 40mg,用 HPLC 测定泪液和房水中药物浓度,结果表明眼膏中的药物在结膜囊内的滞留时间比眼液大大延长。

6 鼻用制剂

李平等^[12]用氧氟沙星、醋酸、甘油等物质配制出滴鼻液,临床用于急、慢性鼻炎、鼻窦炎

治疗, 疗效确切。他们将滴鼻液 pH 值调为 5.5 ~ 6.5, 符合鼻腔用药生理特点, 具有良好的稳定性, 醋酸不仅有增溶作用, 并可保持原有的抗菌活性。陈文诚^[13]报道了新的配方, 改滴鼻给药为鼻腔喷雾给药。喷雾后药液均匀分布于鼻腔内, 是一种新的给药方式。

7 其他制剂

景利等^[14]以氧氟沙星作为模型药物, 制备了氧氟沙星人工骨, 临床上既可作为支架材料有效地修复骨缺损, 又能在慢性骨髓炎、骨结核、骨肿瘤或瘤样病变等手术刮出后的骨腔充填, 使病灶区域有较高的药物浓度, 从而有效地杀灭残留的病菌。李平等^[15]以壳聚糖、甘油为辅料, 制备了氧氟沙星涂膜剂, 具有良好的生物相容性、柔韧性、保湿性及成膜性, 并可促进创伤面的再生、修复和愈合。

参考文献

- 1 卫祥云, 张碟婉. 氧氟沙星膜剂治疗淋菌性宫颈炎 54 例疗效观察. 中国医院药学杂志, 1997, 17(12): 571
- 2 孙国明, 汪利民, 李芸. 氧氟沙星涂剂的制备. 现代应用药学, 1995, 12(1): 35
- 3 庄志铨, 罗勤, 冯艳. 氧氟沙星软膏的制备. 中国医院药学杂志, 1998, 18(2): 87

- 4 靳培英, 王怀劬, 刘训荃等. 氧氟沙星凝胶外用的临床疗效. 临床皮肤科杂志, 1995, 1: 25
- 5 杨继章, 陈丽芳. 复方氧氟沙星口腔溃疡膜的制备及临床应用. 中国医院药学杂志, 1997, 17(9): 415
- 6 王震, 朱兴年, 于骥等. 氧氟沙星复合膜的制备与质量控制. 药学实践杂志, 1996, 14(5): 282
- 7 Yamagami H, Takamori A, Sakamoto T et al. Intrapocket chemotherapy in adult periodontitis using a new controlled release insert containing ofloxacin. J Periodontol, 1992, 63(1): 2
- 8 董学文. 复方氧氟沙星滴耳油配制及临床疗效观察. 医学理论与实践, 1998, 11(9): 封 4
- 9 胡容峰, 王家骅. 氧氟沙星滴丸的研制. 中国医院药学杂志, 1995, 15(5): 208
- 10 朱伟燕. 氧氟沙星滴眼液的制备及疗效. 中国医院药学杂志, 1997, 17(9): 431
- 11 周静圣. 氟喹酮眼膏在结膜囊内滞留浓度的测定. 中华眼科杂志, 1991, 27(2): 115
- 12 李平, 朱旭江. 氧氟沙星滴鼻液的制备及质量控制. 中国医院药学杂志, 1998, 18(4): 186
- 13 陈文诚. 复方氧氟沙星鼻喷剂的稳定性实验. 药学实践杂志, 1998, 16(2): 95
- 14 景利, 曾仁杰, 张勤等. 氧氟沙星人工骨缓释特性的实验研究. 中国药学杂志, 1998, 33(8): 473
- 15 李平, 姚南, 张建林等. 氧氟沙星涂膜剂的制备及质量控制. 中国医药工业杂志, 1999, 30(3): 123

(收稿: 1998-12-30)

头孢唑啉钠与氨茶碱、三氮唑核苷在 5% 葡萄糖注射液中的配伍实验

刘延凤 莫宗琪 吴金虎(济南军区青岛第一疗养院药剂科 青岛 266071)

摘要 目的: 研究头孢唑啉钠与氨茶碱、三氮唑核苷在 5% 葡萄糖注射液中的配伍变化, 供临床应用参考。方法: 配伍实验采用紫外分光光度法和 HPLC 色谱法进行。结果: 头孢唑啉钠与氨茶碱配伍溶液色泽加深, 含量略有下降, 其余各组色泽未变, 含量略有下降。结论: 头孢唑啉钠与氨茶碱不能联合应用; 头孢唑啉钠与三氮唑核苷可联合应用, 但最好在 6h 用完。

关键词 头孢唑啉钠; 氨茶碱; 三氮唑核苷

Compatibility of cefazolin with aminophylline and ribavirin injection solution in 5% glucose injection solution

Liu Yanfeng, Mo Zongqi, Wu Jinhu (Department of pharmacy, the first sanatorium of Jinan military region, Qingdao 266071)