

- [7] Martin L. et al: *Journal of Gerontology* 38 (5) : 525, 1983
- [8] 段奇玉等: *老年学杂志*, 7 (1) : 61, 1987

- [9] Bozovic Vera et al: *Age*, 9 (2) : 41, 1986
- [10] Heidrick Margraet L. et al: *Mech Ageing Dev*, 27 (3) : 341, 1984

## 碘 的 络 合 物

广州市南方医院药局

李国锋 石兴华

碘为合成甲状腺激素的原料,当人体缺乏碘时,引起地方性甲状腺肿,大量的碘有抗甲状腺的作用,在甲亢病人表现尤为明显。碘的另一特点是杀菌作用,不仅杀菌谱广而且杀菌效力强,对原虫、细菌、真菌以及孢子都有效,文献报道认为碘是最有效的局部消毒剂。然而用碘作消毒剂有如下缺点:碘有异臭,易挥发,难溶于水(25℃为0.034%),故增加碘的溶解度及稳定性等实质目的是提高碘的效用。碘与其它化合物的络合,一定程度上可满足这些要求。

### 1. 碘—碘化钾 (KI-I<sub>2</sub>)

在水溶液中碘与碘化钾能形成易溶于水的碘—碘化钾络合物,一则增加了碘在水中的溶解度,二则提高了碘的稳定性。用碘化钾作碘的助溶剂、稳定剂配制碘溶液时应注意如下问题:碘化钾在近饱和水溶液中才有助溶作用,故应先用少量水溶解碘化钾,再加入碘使络合溶解。另外,碘化钾溶解为吸热反应,低温时(12℃)不易溶解,加热后才能溶解,但此时不应即刻加入碘,应让碘化钾溶液冷却后再加入碘以减少碘的挥发。临床上常用的制剂有碘酊、复方碘溶液、碘注射液等。碘化钾的主要缺点是对肌肉组织有较强的刺激性。如碘酊用于手术前的皮肤消毒,能有效地杀灭皮肤表面的细菌,但对于局部的伤口,刺激性就大。因此使用碘化钾配制碘溶液的另一个问题是,在保证疗效的

同时(也即能保证定量的碘溶解、稳定的条件下),如何最低限度地减少碘化钾的用量。侯氏<sup>(1)</sup>对不同碘化钾量的碘酊进行了碘的稳定性研究,结果表明碘化钾与碘的用量比降至20%,半年内碘的含量无明显变化。据此认为碘与碘化钾在水溶解中发生三级络合反应,除有KI<sub>3</sub>形式的络合物外,还有KI<sub>5</sub>和KI<sub>7</sub>形式的络合物,而且在碘酊中三种络合物都是稳定的。另外,碘与碘化钠可形成和碘与碘化钾相似的络合物,而且使用碘化钠可明显地降低对皮肤粘膜的刺激性,但碘化钠的造价较高。

### 2. 碘伏 (PVP-I)

碘伏又称聚乙烯吡咯烷酮碘,其制备方法是<sup>(2)</sup>:将干的聚乙烯吡咯烷酮(PVP)与碘经长时间固相混合与加热反应后,碘完全与PVP形成复合物,此复合物即PVP-I。PVP-I国内也有合成报道<sup>(3)</sup>。本品为棕褐色粉末,其主要优点是:作用与碘相似,但无碘的特臭,失去了碘的挥发性质,易溶于水,在水溶液中缓慢游离出碘而起作用。效力持久,浓度稳定。对皮肤粘膜无刺激性,不引起过敏反应,局部应用时,不与蛋白结合。Saggers<sup>(4)</sup>报道,PVP-I对150多株从临床上分离的细菌有杀菌作用。10分钟内所有细菌均杀灭;5分钟内,除7株(其中5株为金黄色葡萄球菌)外,其余均被杀灭;30秒钟内也可杀灭大多数细菌。六十年代

起,国外广泛应用PVP-I于外科灭菌和口腔、妇科慢性溃疡的治疗。国外临床使用的PVP-I溶液常用浓度为10% (含1%有效碘)。据报道<sup>(5)</sup>,使用白糖加聚乙烯吡咯烷酮碘治疗大面积Ⅲ度烧伤,与磺胺嘧啶银和硫酸庆大霉素比较,疗效显著。PVP-I的杀菌作用和白糖能降低微生物活性及营养作用,在治疗中起到了协同作用。

### 3. 洗必泰碘

洗必泰碘是碘与洗必泰形成的络盐。1979年汤氏<sup>(6)</sup>制得了洗必泰碘。方法是:取碘化钾60g溶于80ml热水中(80℃左右),再加碘片45g,迅速搅匀,立即乘热倾入已预热至90℃左右的10%盐酸洗必泰水溶液300ml中,不断搅拌,立即析出洗必泰碘络盐。放置12小时以上,倾出上清液,得棕黑色半固体块状物,室温干燥即得。同一时期张氏<sup>(7)</sup>也制备了洗必泰碘。文献报道洗必泰碘络盐的碘含量为45%(CA66:88643)。洗必泰碘杀菌效果较洗必泰与碘强大,对G<sup>+</sup>、G<sup>-</sup>细菌及芽胞均有强大的杀灭作用,且对病毒也有一定的灭活作用。3分钟即可达到百分之百的细菌被杀灭,杀菌作用可保持数小时(在皮肤上形成了稳定的保护膜),临床上使用的制剂有1%洗必泰碘乳膏,1%洗必泰碘涂膜剂等。涂膜剂不能用于渗出物较多之创面。卢氏<sup>(8)</sup>制备了洗必泰碘络盐溶液,同时进行了稳定性考察,结果是1%洗必泰碘络盐溶液室温存放三个月后,碘含量下降10%,故不宜存放过久,以免降低疗效。

### 4. 环糊精—碘络合物(CyD-I)

近期国内文献未见报道,CA上较早就有报道。环糊精用作药物的包合物,从而增加药

物的稳定性、溶解度等。近来研究得较多,其中β-环糊精最常用。国外报道的CyD-I的制备方法是:12g碘和8g碘化钾在水中,加50gβ-环糊精,在80℃搅拌,混合物保留一天,得到的包合物用水冲洗,干燥即得(CA86:28620b)。β-环糊精碘无碘的臭味,含有效碘量为8%,室温放置一个月重量不减少。临床上使用β-环糊精—碘加到含漱液中作为杀菌剂,效果良好,能有效地杀灭口腔细菌,如肺炎球菌、葡萄球菌、绿脓杆菌、白喉棒状杆菌等。考虑到β-环糊精本身在水中溶解度较小(1.85%,室温),以及其羟丙基<sup>(9)</sup>及甲基<sup>(10)</sup>衍生物在水中的溶解度明显地增加这一点,故就增加碘的溶解度来说,后两者可能更好,但结果需要实验得到进一步证实。目前就环糊精的造价以及环糊精—碘络合物含碘量不高这些方面来看,环糊精—碘大量推广到临床使用尚有一段距离。

### 参 考 文 献

- [1] 侯世祥: 中国医院药学杂志, 1984; 4(11): 31
- [2] Rabinowitz J: New Drug, 1961; 1: 39
- [3] 陆光裕: 医药工业, 1987; 18(2): 74
- [4] Saggars B. A. et al: J. Hyg Camb. 1964; 62: 509
- [5] 金内: 药局, 1985; 36(10): 143
- [6] 汤关龙: 药学通报, 1979; 4: 164
- [7] 张水恒: 药学通报, 1979; 4: 165
- [8] 卢仲清: 药学通报, 1983; 18(2): 9
- [9] Pitha J et al: Int. J. Pharm. 1986; 29(1): 73
- [10] Elgendy GA. et al: Int. J. Pharm. 1986; 31(1-2): 25

欢迎刊登广告, 具体事宜来函联系!