

## 深受患儿及家长欢迎的新制剂。

## 参考文献

- 1 李涛, 王海峰. HPLC 测定复方硫酸氢黄连素灌肠液的含量. 中国药学杂志, 1995, 30(3): 177
- 2 庞貽慧, 鲁纯梦编. 药物稳定性预测方法. 北京: 人民卫生出版社, 1984. 35~ 52

- 3 奚念朱, 顾学裘主编. 药剂学. 第 2 版, 北京: 人民卫生出版社, 1987. 116~ 21
- 4 鲁会侠, 李爱武, 傅燕芳. 甲氧苄氨嘧啶对黄连素活性的影响. 中成药, 1989, 11(4): 42
- 5 秦伯益主编. 新药评价概论. 北京: 人民卫生出版社, 1989. 100

(收稿: 1998- 05- 26)

## 环丙沙星制剂的临床应用

李 平 李秀兰(解放军第 148 医院 淄博 255300)

**摘要** 目的: 综述目前环丙沙星多种制剂在临床中的应用。方法: 广泛收集环丙沙星多种制剂和临床应用资料。结果与结论: 环丙沙星的不同制剂在临床抗感染方面得到了广泛的应用。

**关键词** 环丙沙星; 制剂; 临床应用

环丙沙星(Ciprofloxacin, CPLX)是目前氟喹诺酮类抗菌药中应用最广泛的品种, 具有广谱、高效、低毒等优点, 临床应用对全身各系统, 包括呼吸、泌尿、胃肠、皮肤软组织、骨等感染均有良效。笔者根据近年来临床应用中研制的各种环丙沙星制剂作一概述。

## 1 治疗牙周疾病的制剂

牙周病是口腔科常见病, 是以革兰氏阴性厌氧杆菌为主所引起的疾病。陈安兰等<sup>[1]</sup>研制了复方环丙沙星复合膜, 治疗口腔溃疡, 效果显著。此种复合膜采用 PVA<sub>05-88</sub>, CMC-Na 等成为膜材料, 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唾液接触, 药物呈单向释放, 增加药膜在用药部位停滞时间, 同时在膜材中加入甲硝唑、核黄素、地卡因等物质以提高疗效。杨莲芝等<sup>[2]</sup>报道了用替硝唑(10%)、乳酸环丙沙星(按碱基计 5%), 加一定量的粘合剂和赋形剂形成消炎牙棒, 治疗牙周炎、牙周脓肿、慢性根尖炎、龋齿等多种牙科疾病。应用时, 局部用 3% 双氧水冲洗后将牙棒放置在龋齿洞或牙周袋内。

## 2 术后局部抗感染的制剂

乳突炎根治术后按常规用碘纺纱条填塞, 但碘纺有不适宜的臭味, 且近年来无货供应, 而凡

士林纱条无消炎作用, 填塞后易致继发性感染。朱亚人等<sup>[3]</sup>研制了环丙沙星纱条, 以西黄蓍胶为稳定剂, 配成 0.3% 盐酸环丙沙星溶液后, 再制成每克含主药 10mg 的凡士林纱条, 填塞术腔, 疗效可靠。本制剂还可用于上颌窦根治术, 鼻中隔矫正术及腭裂的手术。王志朝等<sup>[4]</sup>以聚己烯醇和羧甲基纤维素钠为成膜材料, 配以氢化可的松、云南白药酊、达克罗宁等药物, 制成复方环丙沙星鼻腔膜, 具有抗菌、消炎、抗过敏、止血、止痒、促进创面愈合等作用。用于鼻部手术、鼻衄患者。

## 3 治疗皮肤疾患的制剂

环丙沙星还被制成外用制剂, 应用于化脓性感染的皮肤病。宋俊生等<sup>[5]</sup>利用环丙沙星的两性性质, 将其制成酸式盐与碱式盐溶液, 再使等当量混合, 形成中性水合物微晶, 将此微晶以 O/W 型乳膏剂基质配成无刺激性的中性乳膏。吴原<sup>[6]</sup>将环丙沙星 500ml 加入 5% 硫磺霜 20g 中, 治疗痤疮, 效果较好。另外, 有报道环丙沙星软膏治疗化脓性感染皮肤病<sup>[7]</sup>(脓疮、毛囊炎、疖肿、须疮、湿疹合并感染, 皮癣合并感染, 溃疡合并感染), 临床应用效果较好。殷乐平<sup>[8]</sup>以十二烷基硫酸钠为乳化剂, 以十八醇、白凡士林、液状石蜡为基质制成了 O/W 型环丙沙星乳

膏。

#### 4 抗菌性前列腺炎的制剂

慢性细菌性前列腺炎是泌尿外科常见病, 由于前列腺血液灌注相对较差, 全身用药往往不能获得较好的疗效, 同时由于直肠和前列腺之间有静脉回流和淋巴交通, 使药物易于达到前列腺组织。因而栓剂治疗较口服和静滴更为安全有效。刘保良等<sup>[9]</sup>研制了两种不同基质的环丙沙星栓。以半合成脂肪酸酯为基质, 生物利用度较高。释药速度和消除速度较快, 而以 PEG400、PEG4000、甘油为基质时, 作用时间相对延长, 毒副作用发生率降低, 也可加入 0.2% 的盐酸丁卡因消除聚乙二醇对粘膜的刺激性。华佳等<sup>[10]</sup>在文章中报道了一种加消炎痛、安定、尿素的环丙沙星栓, 消炎痛缓解非细菌炎症患者症状, 安定消除病人的焦虑、烦恼情绪, 增强治疗效果。

#### 5 治疗化脓性中耳炎的制剂

金凤兰<sup>[11]</sup>研制成 0.5% 环丙沙星滴耳液, 加入甘油可以减少本品刺激性和维持作用时间持久。章力行等<sup>[12]</sup>以醋酸-醋酸钠缓冲液将 pH 值控制在 4~6 之间, 用氯化钠调节渗透压, 制成盐酸环丙沙星滴耳液。制成的滴耳液呈弱酸性, 以利于耳内感染的控制。

#### 6 治疗眼部感染的制剂

环丙沙星对眼部感染的主要致病菌也显示较强的抗菌作用。罗明生等<sup>[13]</sup>用 EDTA-2Na 作稳定剂, PYP-K30 作增粘剂和滞留剂, 尼泊金甲酯、乙酯作防腐剂, 硼砂、硼酸作缓冲液, 制成乳酸环丙沙星滴眼液, 治疗慢性结膜炎、角膜炎、睫状体炎、麦粒肿等, 稳定性好, 无刺激、疗效佳。张志萍等<sup>[14]</sup>也报道了一种盐酸环丙沙星滴眼液治疗眼部感染, 并经实验观察, 1μg/ml 环丙沙星对革兰氏阳性球菌、革兰氏阴性球菌及绿脓杆菌的累积抑菌百分率为 100%。

#### 7 抗全身感染的制剂

目前环丙沙星用于抗全身感染的制剂有注射剂、片剂、胶囊剂等, 用于治疗各系统、器官的感染, 如肝脓肿、胆道感染、伤寒、菌痢、尿路感

染、肾盂肾炎、淋病、肺部感染以及败血症、术后感染。另外环丙沙星对恶性肿瘤、艾滋病、肾移植等及其它多种细菌感染的治疗有不容忽视的潜力。

#### 8 其它

陈洪轩等<sup>[15]</sup>研制成功了阴道泡腾片, 治疗性传播疾病及妇科感染, 将无水乙醇、吐温-80、甘油、PVP-K30 搅拌溶解制备粘合剂, 将乳酸环丙沙星、酒石酸、碳酸氢钠混匀加粘合剂制颗粒, 加入 L-HPC、硬脂酸镁混匀压片, 使片剂在阴道中崩解后辅料相互作用产生泡腾作用。

#### 参考文献

- 1 陈安兰. 复方环丙氟哌酸复合膜的研制. 现代应用药学, 1993, 10(6): 33
- 2 杨莲芝. 复方消炎牙棒的制备和临床应用. 华西药学期刊, 1997, 12(4): 267
- 3 朱亚人. 环丙沙星纱条临床应用. 现代应用药学, 1995, 12(2): 45
- 4 王志朝. 复方环丙沙星鼻腔膜的研制及临床疗效观察. 中国抗生素杂志, 1992, 17(2): 154
- 5 宋俊生. 微晶诺氟沙星和微晶环丙沙星乳膏的制备. 中国医药工业杂志, 1993, 24(7): 303
- 6 吴原. 环丙沙星外用治疗痤疮 100 例. 中国皮肤性病学期刊, 1994, 8(2): 122
- 7 李思奉. 环丙沙星软膏治疗化脓性感染性皮肤病的临床验证报告. 贵州医药, 1994, 18(5): 464
- 8 殷乐平. 环丙沙星乳膏的研制. 中国医院药学杂志, 1997, 17(10): 464
- 9 刘保良. 环丙沙星栓的药动学研究及治疗慢性细菌性前列腺炎的疗效. 中国医院药学杂志, 1997, 17(10): 447
- 10 华佳. 复方环丙沙星栓的制备及治疗慢性前列腺炎的初步研究. 现代应用药学, 1995, 12(1): 32
- 11 金凤兰. 环丙沙星治疗化脓性中耳炎. 新药与临床, 1996, 15(3): 189
- 12 章力行. 紫外分光光度法测定环丙沙星滴耳液的含量. 现代应用药学, 1993, 10(5): 41
- 13 罗明生. 环丙沙星滴眼液的研制及应用. 中国药房, 1994, 5(4): 17
- 14 张志萍. 盐酸环丙沙星滴眼液的制备及药效研究. 中国医院药学杂志, 1995, 15(3): 118
- 15 陈洪轩. 乳酸环丙沙星阴道泡腾片的研制. 西北药学期刊, 1996, 11(5): 219

(收稿: 1998-06-15)