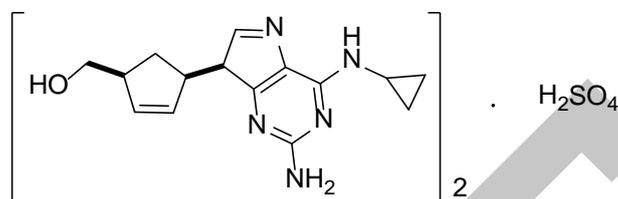


## 硫酸阿巴卡維

### Abacavir Sulfate



$(C_{14}H_{18}N_6O)_2 \cdot H_2SO_4$

分子量：670.74

化學物質登錄碼：188062-50-2

本品為(1*S*,4*R*)-鏡像異構物，所含硫酸阿巴卡維 $[(C_{14}H_{18}N_6O)_2 \cdot H_2SO_4]$ 按不含溶劑無水物計算應為 97.0~102.0%。

#### 性狀：

- (1) 一般性狀—本品為白色至灰白色粉末。
- (2) 溶解度—本品可溶於水、乙酸乙酯、絕對酒精及甲醇。

#### 鑑別：

- (1) 取本品按紅外光吸光度測定法（通則 1008）溴化鉀錠法測定之，其吸收光譜與本品對照標準品以同法測得者，僅於相同波長處呈最大吸收。
- (2) 按有機不純物項下方法二操作所得層析圖譜，檢品溶液與系統適用性測試液主波峰之滯留時間相同。

(3) 5 mg/mL 本品溶液呈硫酸鹽之各種特殊反應（通則 2001）。

**雜質、不純物限量、一般檢查及其他規定：**

(1) 熾灼殘渣—本品熾灼後，遺留殘渣不得超過 0.2%（通則 3002）。

(2) 水分—本品按照水分測定法（通則 3010）庫倫滴定法測定之，其所含水分不得超過 0.5%。

(3) 有機不純物—

**方法——類緣化合物**

溶液 A—三氟乙酸：水（0.05：99.95）混液。

溶液 B—甲醇：水（17：3）混液。

移動相—如下方梯度表所示。

時間（分）	溶液 A（%）	溶液 B（%）
0	95	5
20	70	30
35	10	90
35.1	95	5
50	95	5

系統適用性測試液—取阿巴卡維類緣化合物混合對照標準品適量，溶於水，使成濃度為 0.25 mg/mL 之溶液。（阿巴卡維類緣化合物混

合對照標準品係為戊二酸阿巴卡維、阿巴卡維 *O*-嘧啶衍生物、消環丙基阿巴卡維、反式阿巴卡維及阿巴卡維三級丁基衍生物之混合物。)

檢品溶液—取本品適量，溶於水，使成濃度為 0.25 mg/mL 之溶液。

層析系統—液相層析系統，具波長 254 nm 檢測器，3.9 mm×15 cm 層析管，充填 5 μm C18 之多孔性矽石或陶瓷微粒 (L1)。層析管溫度維持 30°，移動相流速為 1 mL/min，注入量為 20 μL。

系統適用性—取系統適用性測試液，按照下述測定法層析之，記錄其波峰值：阿巴卡維與反式阿巴卡維二者波峰間之解析度 *R* 不得小於 1.5。

測定法—取檢品溶液，注入層析系統層析之，記錄其層析圖譜，測計各波峰值。按照下列公式計算所取本品含每一不純物之百分比：

$$100 (r_U / r_T)$$

$r_U$ ：檢品溶液測得每一不純物之波峰面積。

$r_T$ ：檢品溶液測得所有波峰面積之總和。

允收基準—個別不純物如表 1 所示，不純物之總量不得大於 0.8%。

表 1

不純物名稱	相對滯留時間	允收基準， 不得大於 (%)
消環丙基阿巴卡維 <sup>a</sup>	0.65	0.2

阿巴卡維	1.00	—
反式阿巴卡維 <sup>b</sup>	1.04	0.2
阿巴卡維 <i>O</i> -嘧啶衍生物 <sup>c</sup>	1.33	0.2
阿巴卡維三級丁基衍生物 <sup>d</sup>	1.67	0.2
任一非特定不純物	—	0.1
<sup>a</sup> [(1 <i>S</i> ,4 <i>R</i> )-4-(2,6-Diamino-9 <i>H</i> -purin-9-yl)cyclopent-2-enyl]methanol. <sup>b</sup> {(1 <i>R</i> ,4 <i>R</i> )-4-[2-Amino-6-(cyclopropylamino)-9 <i>H</i> -purin-9-yl]-cyclopent-2-enyl}methanol. <sup>c</sup> <i>N</i> <sup>6</sup> -Cyclopropyl-9-[(1 <i>R</i> ,4 <i>S</i> )-4-[(2,5-diamino-6-chloropyrimidin-4-yloxy)methyl]cyclopent-2-enyl]-9 <i>H</i> -purine-2,6-diamine. <sup>d</sup> 9-[(1 <i>R</i> ,4 <i>S</i> )-4-( <i>tert</i> -Butoxymethyl)cyclopent-2-enyl]- <i>N</i> <sup>6</sup> -cyclopropyl-9 <i>H</i> -purine-2,6-diamine.		

#### 方法二—鏡像異構物純度

溶液 A—庚烷：異丙醇：二乙胺（850：150：1）混液。

溶液 B—庚烷：異丙醇（1：1）混液。

移動相—如下方梯度表所示。

時間（分）	溶液 A（%）	溶液 B（%）	流速（mL/min）
0	100	0	1.0

25	100	0	1.0
27	0	100	0.8
37	0	100	0.8
39	100	0	1.0
55	100	0	1.0

稀釋液—甲醇：三氟乙酸（200：1）混液。

系統適用性測試液—取阿巴卡維立體異構物混合對照標準品適量，置適當容量瓶，加入相當於最終體積 30% 之稀釋液。以超音波震盪至固體完全溶解後，加入相當於最終體積約 30% 之異丙醇，混勻，並以庚烷稀釋至容量，使成濃度為 0.4 mg/mL 之卡維溶液。（阿巴卡維立體異構物混合對照標準品係為硫酸阿巴卡維、阿巴卡維鏡像異構物及反式阿巴卡維之混合物。）

檢品溶液—取本品 4 mg，置於 10 mL 容量瓶，加入稀釋液 3 mL，以超音波振盪至固體完全溶解後，再加入異丙醇 3 mL，混勻，並以庚烷稀釋至容量。

層析系統—液相層析系統，具波長 286 nm 檢測器，4.6 mm×25 cm 層析管，充填 10 μm 直鏈澱粉-三-3,5-二甲基苯胺甲酸酯鍵結球形多孔性矽石微粒（L51）。層析管溫度維持 30°，注入量為 20 μL。

系統適用性—取系統適用性測試液，按照下述測定法層析之，記錄

其波峰值：其相對滯留時間設阿巴卡維為 1.0，反式阿巴卡維與阿巴卡韋鏡像異構物分別為約 0.8 及 0.9；反式阿巴卡維與阿巴卡維鏡像異構物二者波峰間之解析度  $R$  不得小於 1.0；阿巴卡維鏡像異構物與阿巴卡維二者波峰間之解析度  $R$  不得小於 1.5。

測定法—取檢品溶液，注入層析系統層析之，記錄其層析圖譜，測計各波峰值。按照下列公式計算所取本品含阿巴卡維鏡像異構物之百分比：

$$100 (r_U / r_T)$$

$r_U$ ：檢品溶液測得阿巴卡維鏡像異構物之波峰面積。

$r_T$ ：檢品溶液測得阿巴卡維與阿巴卡維鏡像異構物波峰面積之總和。

允收基準—阿巴卡維鏡像異構物不得超過 0.3%。

#### 含量測定：

移動相—乙腈：磷酸：水（20：1：180）混液。

標準品溶液—取硫酸阿巴卡維對照標準品適量，溶於水，使成濃度為 0.04 mg/mL 之溶液。

檢品溶液—取本品適量，溶於水，使成濃度為 0.04 mg/mL 之溶液。

層析系統—液相層析系統，具波長 254 nm 檢測器，4.6 mm×5 cm 層析管，充填 5 μm C18 之多孔性矽石或陶瓷微粒（L1）。層析管溫度維持 30°，移動相流速為 1 mL/min，注入量為 20 μL。

系統適用性—取標準品溶液，按照下述測定法層析之，記錄其波峰值：重複注入，相對標準差不得大於 1.5%。

測定法—取檢品溶液與標準品溶液等量，分別注入層析系統層析之，記錄其層析圖譜，測計各波峰值。按照下列公式計算所取本品含硫酸阿巴卡維[(C<sub>14</sub>H<sub>18</sub>N<sub>6</sub>O)<sub>2</sub>·H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>]之百分比：

$$100 (r_U / r_S) (C_S / C_U)$$

$r_U$ ：檢品溶液測得阿巴卡維之波峰面積。

$r_S$ ：標準品溶液測得阿巴卡維之波峰面積。

$C_S$ ：標準品溶液所含硫酸阿巴卡維之濃度（mg/mL）。

$C_U$ ：檢品溶液所含硫酸阿巴卡維之濃度（mg/mL）。

允收基準—按不含溶劑無水物計算應為 97.0~102.0%

包裝與儲存：本品應置於密蓋容器內，於室溫下貯之。

用途分類：抗病毒劑。