

不同粉碎度野生西洋参人参皂苷 Rb₁ 的体外溶出度研究

卓丹如¹, 阙慧卿², 章 宁¹, 林 绥², 钱丽萍², 林善财¹

1. 福州瑞来春堂生物科技有限公司, 福建 福州 350001

2. 福建省医学科学研究院, 福建 福州 350001

摘要: **目的** 采用体外溶出法考察野生西洋参细粉、极细粉与超微粉人参皂苷 Rb₁ 的溶出速率与溶出度。**方法** 按 2010 年版《中国药典》规定进行不同粉碎度野生西洋参粉体外溶出度试验, 绘制溶出曲线, 考察不同粉碎度粉末的体外溶出行为及释药机制。**结果** 前 10 min, 野生西洋参中人参皂苷 Rb₁ 的溶出速率为极细粉>细粉>超微粉, 10 min 后超微粉的溶出率最大, 极细粉的溶出次之, 而细粉溶出最慢。**结论** 野生西洋参粉中人参皂苷 Rb₁ 的溶出速率与粉末本身的粒径和浸润有关, 在粉末浸润后, 超微粉的溶出最快。

关键词: 西洋参; 细粉; 极细粉; 超微粉; 人参皂苷 Rb₁; 体外溶出

中图分类号: R 文献标志码: A 文章编号: 1674-6376(2013)05-0374-03

DOI: 10.7501/j.issn.1674-6376.2013.05.013

In vitro dissolution rate of ginsenoside Rb₁ in superfine powder of wild *Panax quinquefolii* Radix

ZHUO Dan-ru¹, QUE Hui-qing², ZHAN Ning¹, LIN Sui², QIAN Li-ping², LIN Shan-cai¹

1. Fuzhou Ruilaichuntang Biological Technology Co., Ltd., Fuzhou 350001, China

2. Institute of Medical Sciences of Fujian Province, Fuzhou, 350007

Abstract: Objective Using *in vitro* dissolution experiment to study the dissolution rate of ginsenoside Rb₁ in fine powder, very fine powder, and superfine powder of wild *Panax quinquefolii* Radix. **Methods** According to Chinese Pharmacopoeia 2010, the *in vitro* dissolution test of wild *Panax quinquefolii* Radix powder with different comminution degrees was carried out, the dissolution curves were plotted, and the *in vitro* dissolving behavior and drug release mechanism were investigated. **Results** The dissolution rate of very fine powder is higher than that of fine powder and superfine powder at the first 10 min. After 10 min, the dissolution rate of superfine powder is the highest, then those of the very fine powder and the fine powder were the lowest. **Conclusion** The dissolution rate of ginsenoside Rb₁ in wild *Panax quinquefolii* Radix powder is related with the powder particle size and infiltration, the dissolution rate of the superfine powder is the highest.

Key words: *Panax quinquefolii* Radix; fine powder; very fine powder; superfine powder; ginsenoside Rb₁; *in vitro* dissolution

西洋参 *Panax quinquefolii* Radix 为五加科人参属植物西洋参 *Panax quinquefolium* L. 的干燥根^[1], 俗名花旗参, 主产在美国和加拿大, 为广泛应用的贵重保健品。西洋参具有抗疲劳、抗缺氧、抗癌、抗衰老等作用, 可增强机体耐缺氧能力, 保护心脏; 具有增强学习与记忆的功能, 还具有防治动脉粥样硬化、调节血脂代谢等药理作用^[2]。杨连威等^[3]报道, 中药超微粉碎后可提高药物中有效组分的溶出率, 增大药物的生物利用度, 有利于保存生物活性成分, 节省药材, 降低药物用量等优点^[4]。

本实验将劲升·野山花旗参粉碎成细粉、极细粉和超微粉 3 种粉末进行体外溶出试验, 采用 HPLC 法测定溶出液主要有效成分之一人参皂苷 Rb₁ 的量, 绘制溶出曲线, 考察野生西洋参超微粉人参皂苷 Rb₁ 体外 90 min 内的溶出行为, 及其与极细粉、细粉的溶出曲线差异。

1 仪器与材料

1.1 仪器

LC—20AT 岛津高效液相色谱仪 (日本岛津公司), RCZ—8 型溶出度测定仪 (上海黄海药检仪器

收稿日期: 2013-01-24

作者简介: 卓丹如 (1980—), 女, 执业中药师, 主要从事中药生产管理、质量管理工作。Tel: 18650365299 E-mail: 532056077@qq.com

有限公司), AL-204 电子天平(梅特勒-托利多仪器上海有限公司)。

1.2 试药

人参皂苷 Rb_1 对照品(中国食品药品检定研究院提供, 供含量测定用, 批号 110704-201122)。劲升·野山花旗参细粉(50 目, $150\sim 180\ \mu\text{m}$)、极细粉(200 目, $50\sim 100\ \mu\text{m}$)、超微粉(1 000 目, $13\sim 20\ \mu\text{m}$)由福州瑞来春堂生物科技有限公司提供, 原产地为美国, 批号 Y03120901, 甲醇、乙腈为色谱纯, 磷酸为分析纯, 由国药集团化学试剂有限公司生产, 超纯水为自制。

2 方法与结果

2.1 色谱条件^[5]

色谱柱为十八烷基键合硅胶柱, 流动相为水-乙腈(70:30), 检测波长 203 nm, 体积流量 1.0 mL/min, 柱温 $40\ ^\circ\text{C}$, 进样量为 $10\ \mu\text{L}$ 。

2.2 对照品溶液的配制

精密称取人参皂苷 Rb_1 对照品 10.1 mg 于 5 mL 量瓶中, 加甲醇至刻度, 摇匀, 即为 2 mg/mL 对照品溶液。

2.3 标准曲线的建立

精密吸取人参皂苷 Rb_1 对照品溶液 2.5 mL 于 5 mL 量瓶中, 加甲醇至刻度, 摇匀即得 1 mg/mL

对照品溶液。同法分别配制质量浓度为 1.0、0.8、0.4、0.2、0.1 mg/mL 的对照品溶液, 按上述色谱条件进样, 以峰面积对质量浓度进行回归, 得回归方程为 $A=5\times 10^6 C-76\ 867$, $R^2=0.998\ 5$, 表明人参皂苷 Rb_1 对照品在 $0.1\sim 1.0\ \text{mg/mL}$ 线性关系良好。

2.4 溶出实验

2.4.1 实验条件^[6] 溶出介质为超纯水 200 mL, 转速 100 r/min, 杯内温度 $36.5\ ^\circ\text{C}$ 。

2.4.2 实验方法 精密称定不同粉碎度野生西洋参粉末约 1 g, 每个样品平行取 6 份, 按《中国药典》2010 年版规定, 采用转篮法进行溶出试验, 定时 5 min 取样 5 mL, 30 min 后, 在 60 min 和 90 min 时分别取样 5 mL, 并及时补充 5 mL 新鲜的溶出介质。样液用 $0.45\ \mu\text{m}$ 微孔滤膜滤过, 滤液蒸干, 残渣用约 2 mL 甲醇分 5 次洗涤, 洗涤液完全转移至 2 mL 量瓶中, 加甲醇至刻度, 摇匀, 得样品溶液。

2.4.3 溶出度测定 精密吸取 $20\ \mu\text{L}$ 样品溶液注入 HPLC 色谱仪, 按色谱条件, 测定峰面积, 代入回归方程, 计算溶出率, 以溶出率为纵坐标, 取样时间为横坐标, 绘制溶出率曲线(图 1), 从溶出率曲线考察各个样品的溶出行为。

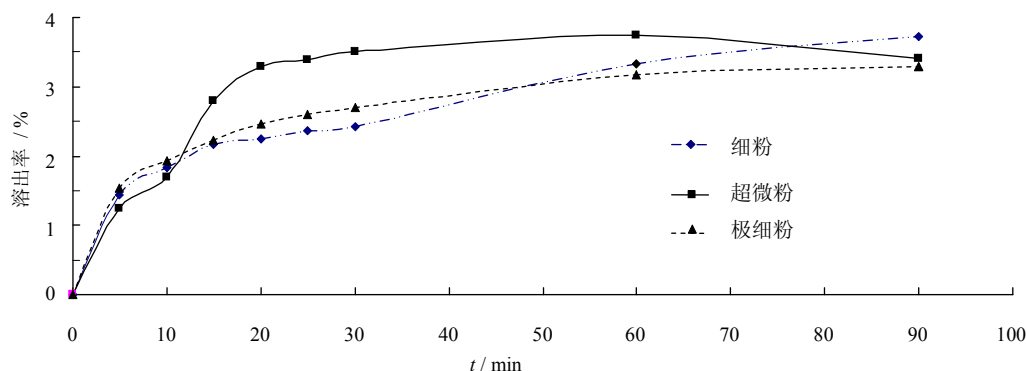


图 1 野生西洋参不同粒径粉末人参皂苷 Rb_1 溶出率曲线图

Fig. 1 Dissolution curves of ginsenoside Rb_1 in wild *Panax quinquefolii Radix* powder with different particle sizes

从溶出曲线可以看出, 3 个样品因为粒径不同, 在溶出行为上也存在明显差异。在溶出开始的前 10 min, 极细粉的人参皂苷 Rb_1 溶出率稍微大于细粉, 细粉大于超微粉, 但不太明显。在 10 min 以后, 野生花旗参超微粉中的人参皂苷 Rb_1 迅速溶出, 在 20 min 时溶出率达到 3.5%, 并在 90 min 内基本保持不变, 野生西洋参极细粉的溶出率次之, 在 30 min 左

右达到平衡, 人参皂苷 Rb_1 溶出率为 2.7%。野生花旗参细粉溶出率在 90 min 内表现不如超微粉和极细粉, 其溶出率曲线呈缓慢上升趋势, 在约 80 min 时溶出率与超微粉接近。

3 讨论

本实验以超纯水为溶出介质, 对野生西洋参细粉、极细粉和超微粉中人参皂苷 Rb_1 的溶出行为进

行考察,从溶出曲线可知,在溶出开始的前 10 min,人参皂苷 Rb₁ 的溶出率为极细粉>细粉>超微粉,10 min 以后,人参皂苷 Rb₁ 的溶出率为超微粉>极细粉>细粉。

目前,国内外对“超微粉”这一名词尚无严格的界定,有人定义粒径小于 100 μm 的为“超微粉”,也有人定义粒径小于 1 μm 的为“超微粉体”。但通常的习惯做法是小于 500 目(即 30 μm)以下的粉体,即称之为“超微粉”。中药材进行超微粉碎,成为中药材超微粉,一般认为其颗粒径在 1~75 μm,大多数中药材超微粉平均粒径小于等于 15 μm,本实验所用花旗参粉属细粉、极细粉和中药材超微粉。张晶等^[8]报道,中药材超微粉碎以破坏细胞壁为目的,从而提高有效成分的溶出率,但达到某一粒径时,有效成分溶出量基本趋于恒定,粒径介于 0.5~1 μm 的人参超微粉的溶出量最高。观察本实验所得的溶出率曲线可知,以超纯水为溶出介质,在溶出开始的前 10 min,极细粉的人参皂苷 Rb₁ 溶出率稍微大于细粉,细粉又稍大于超微粉,可能是由于极细粉的粒径利于溶出介质渗入,而超微粉由于粒径较小,阻碍溶出介质渗入,所以溶出较慢。10 min 以后,超微粉、极细粉和细粉的润湿度慢慢接近,

因为超微粉与溶出介质的接触面大于细粉和极细粉,所以溶出率迅速升高并达到平衡,而细粉和极细粉在 90 min 内溶出率呈缓慢上升趋势。超微粉碎有利于劲升·野山花旗参人参皂苷 Rb₁ 的溶出。

参考文献

- [1] 王 蕾,王英平,许世全,等.西洋参化学成分及药理活性研究进展 [J].特产研究,2007,3: 73-77.
- [2] 王筠默.西洋参药理作用研究的最新进展 [J].中药药理与临床,2001,17(4): 46-48.
- [3] 杨连威,赵晓燕,李 婷,等.中药超微粉碎后对其性能的影响研究 [J].世界科学技术:中药现代化,2008,16(6): 77-81.
- [4] 罗 刚,陈立庭,周 晶.超微粉碎技术在中药研究中的应用[J].现代药物与临床,2011,26(2): 108-112.
- [5] 石俊英,牟彩萍,何 煜,等.西洋参微粉加工与人参皂苷 Rb₁ 含量的相关性研究 [J].中成药,2004,26(7): 556-558.
- [6] 朱卫丰,黄 洁,傅国强,等.西洋参超微粉与普通粉的溶出度及药效学比较 [J].江西中医学院学报,2003,15(2): 50-51.
- [7] 张 晶,王秀全,王德清,等.超微粉碎对人参中皂苷测定量的影响 [J].食品科学,2009,30(18): 96-98.