

A 芍药苷 B安胎保婴丸 C阴性对照

图 1 样品 HPLC 图谱

3.1 提取条件的选择: 本实验通过对甲醇、50%乙醇、95%乙醇 3种不同提取溶媒进行考察, 结果50%乙醇的提取率最高, 又经超声波提取 2, 3, 4, 5次对比实验, 结果以 50%乙醇为提取溶媒, 超声波提取 3次, 每次 15 min, 芍药苷的含量最高, 且峰形

对称, 分离度好。

3.2 测定波长的选择: 应用紫外分光光度计 (UV-2100)测定芍药苷的紫外吸收光谱图, 确定在 232 nm处有最大吸收, 故选择 232 nm为检测波长。

3.3 流动相的选定: 参考文献^[6-8]报道的几组流动相系统, 均不适合本样品, 经反复摸索实验, 用甲醇-异丙醇-36%乙酸水 (25: 2: 2: 71)为最佳, 芍药苷峰形对称, 分离完全

3.4 稳定性实验: 将制备好的供试品溶液进行分析, 以后每隔 2 h进样一次, 重复 4次, 供试品溶液的吸收面积在 8 h内基本无变化

参 考 文 献

- 1 江苏新医学院. 中药大辞典. 上海: 上海科技出版社, 1977: 2225
- 2 中国药品生物制品检定所中药室. 药品与生物制品, 1976, (3): 226
- 3 刘玉珍, 等. 中成药, 1993, 15(5): 15
- 4 罗国安, 等. 中成药研究, 1988, (1): 10
- 5 史林, 等. 中草药, 1991, 22(1): 306
- 6 杨威, 等. 中成药, 1994, 16(5): 12
- 7 王春明, 等. 药物分析杂志, 1995, 15(2): 53

(1999-2-25收稿)

葛根黄酮胶囊的制备及体外释放动力学

解放军二七二医院 (天津 300020) 郭建平* 孙其荣** 周全** 姚康德*** 成果祥***

摘 要 以 EC/PEG为混合载体, 用固体分散技术制成葛根黄酮胶囊, 与愈风宁心片做了体外释放度的比较. 30 min药物释放分别为: (65.5±13.63)%, (27.86±13.07)%. 10 h药物释放为: (95.70±6.10)%, (76.42±3.3)%. 经方差分析, 胶囊与愈风宁心片之间有显著性差异 (P<0.05). 胶囊 1 h内达峰, 后维持表现零级释放. 而愈风宁心片没有突释效应, 10 h左右释药不完全.

关键词 葛根黄酮胶囊 制备 体外释放动力学

用溶剂法将葛根黄酮与 EC/PEG制成固体分散体胶囊, 此系统为骨架扩散控释体系. 在此系统中, PEG为致乳剂, 此类制剂释药过程介于一级和零级之间, 一般与 $t_{1/2}$ 成正比, 但有些制剂的研究发现溶出符合零级动力学^[朱盛山. 药物新剂型. 北京: 人民卫生出版社, 1993 17] 我们对 EC/PEG葛根黄酮胶囊进行了体外释放度的研究, 与愈风宁心片作了比较, 30 min药物释放分别为: (65.51±3.63)%, (27.86±13.07)%, 10 h药物的释放为 (95.07±6.10)%, (76.42±3.3)%. 经方差分析, 胶囊与愈风宁心片之间, 有显著性差异 (P<0.05).

1 材料和方法

1.1 仪器: 岛津 UV-3000紫外分光光度计 (日本), 751型紫外分光光度计, 2RS-4型智能药物溶出仪 (天津大学无线电厂).

1.2 材料: 葛根黄酮 EC/PEG固体分散体胶囊, 自制; 愈风宁心片: 天津中药厂 (94110).

2 实验部分

2.1 葛根黄酮 EC/PEG胶囊的制备: 将 EC-PEG-葛根黄酮按 (5: 0.4: 1)比例混合均匀, 用溶剂法将其制成固体分散体, 过 60目筛, 装 2号空心胶囊

2.2 释放方法: 中华人民共和国药典 1995年版转

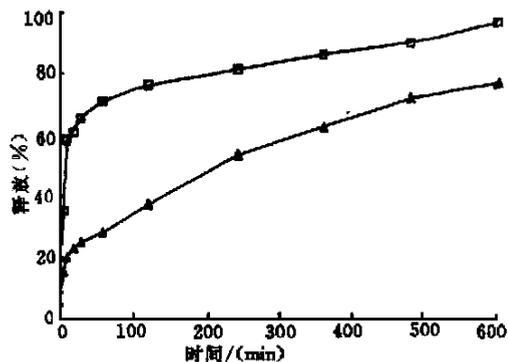
* Address: Guo Jianping, No. 272 Hospital of PLA, Tianjin
** 上海第二军医大学 *** 天津大学

篮法,溶出介质为人工胃液 (pH= 1.2),温度: (37± 0.5) °C,转篮转速 (100± 1) r/min 分别取葛根黄酮胶囊及片剂置转篮中,转篮接触介质开始计时,定时取样 4 mL,精密吸取 0.4 mL置 5 mL容量瓶中,加水至刻度,摇匀。于波长 250 nm处测定吸光度。

3 结果与讨论

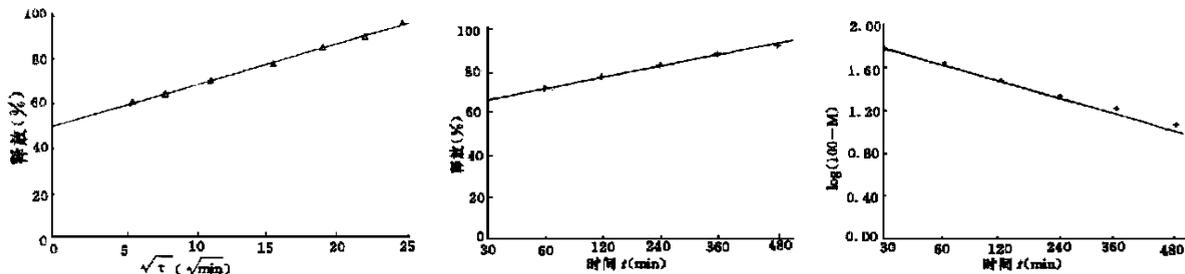
3.1 葛根黄酮胶囊、愈风宁心片体外溶出比较:愈风宁心片、葛根黄酮胶囊溶出度比较见图 1 葛根黄酮胶囊 30 min 药物释放为 65.51%, 10 h 释放 95.57%,达到预期目的。为达到理想的释药效果,可调整 EC/PEG4000适当的比例 愈风宁心片 30 min 药物释放 (27.86± 13.0)% , 10 h 时药物释放 (76.54± 3.30)% ,可见,愈风宁心片释药不完全。

3.2 葛根黄酮胶囊体外溶出动力学:溶出扩散或骨架扩散体系体外释药通常用 Higuchi平方根方程 ($M = Kt^{1/2}$)、一级动力学方程 [$\log(100 - m) = Kt$] 零级动力学方程 ($M = Kt$)拟合,本文用这三个模型



□ 葛根黄酮胶囊 △ 愈风宁心片
图 1 葛根黄酮的释放行为

描述葛根黄酮从胶囊中的释药方式,对 EC/PEG 葛根黄酮胶囊 $t(30 \sim 600 \text{ min}) - M [\log(100 - m)]$, $t^{1/2}(30 \sim 600) - M$, $t(30 \sim 600 \text{ min}) - M$ 进行拟合见图 2,发现在 30 min 后的释药以零级模型拟合优于 Higuchi 及一级模型。



用 Higuchi平方根方程拟合 ($A = 49.2679$ $B = 1.7718$ $r = 0.984$) 用零级动力学方程拟合 ($r = 0.999$) 用一级动力学为模型拟合 ($r = 0.9360$)

图 2 葛根黄酮胶囊释放行为

3.3 理想的控释制剂体外释药速率应符合零级动力学过程 (即恒速释药),但在实际控释制剂的研究中,能够真正达到零级释药的制剂却很少见,常见的控释制剂的体外释药速率均是接近零级速率,或先

突释后在一定时间内符合零级释药^[1]。因此,葛根黄酮胶囊,30 min 内突释,后释放为零级动力学。

(1999-03-01 收稿)

关于编辑、出版以“中药新剂型、新工艺、新技术”为主要内容的 《中草药》杂志 2000 年增刊的征文通知

在科技日新月异发展的世纪之交,高新技术在中药产业中得到广泛的应用,为了加速中药产业的技术创新,本刊拟在 2000 年下半年编辑、出版以“中药新剂型、新工艺、新技术”为主要内容的增刊,现征文通知如下:

征文内容:① 中草药现代生物工程技术的开发与应用如:基因工程、细胞工程、酶工程、代谢工程、发酵工程等现代生物技术对珍贵和濒危动、植物中药材种源的保护、鉴别、优化和可持续利用等技术。② 中草药有效成分提取、分离新技术如:超临界萃取、膜分离、超滤技术、大孔吸附树脂色谱、逆流色谱、澄清技术等。③ 中草药有效成分分析的新仪器、新方法等。④ 中草药现代药理学研究方法如:血清药理学、细胞分子药理学和中药药代动力学等。⑤ 中草药新剂型的研究如:透皮吸收制剂,靶向药物制剂,缓释、控释制剂等。

征文截止时间:2000 年 6 月 30 日。其他要求见《中草药》杂志 2000 年第 1 期“征稿简则”。欢迎广大读者踊跃投稿,来稿请寄天津市鞍山西道 308 号《中草药》杂志编辑部,邮编:300193,稿件上请注明“增刊征文”字样。