

效成分的提取效果影响较小,采用 8 倍量的 60%乙醇提取 3 次,每次 45 min 的工艺条件更适合工业生产情况,可节省乙醇用量,大大地减少了生产成本。

References:

[1] Fu D N, Li X Y. Determination of icariin in Yijing Pill by HPLC [J]. *Lishizhen Med Mater Med Res* (时珍国医国药),

2004, 15 (10): 649-650.

[2] Wang R Y, Jiang H Z, Che H Y. Determination of psoralen and isopsoralen in Zhibao Sanbian Medicated Wine by HPLC [J]. *Chin Pharm Aff* (中国药事), 2004, 18 (2): 116-117.

[3] Tao J Y, Xu S X, Li Z X, et al. Study on extraction process of *Epimedium* [J]. *Lishizhen Med Mater Med Res* (时珍国医国药), 2004, 15 (1): 11-12.

茶多酚脂质体制备的研究

陈荣义¹, 张新申¹, 谢 君²

(1. 四川大学轻纺与食品学院, 四川 成都 610065; 2. 华南农业大学测试中心, 广东 广州 510642)

茶多酚(tea polyphenol, TP),是茶叶中 30 余种多酚类化合物的总称,约占茶叶干重的 30%^[1,2]。茶多酚是一种天然的高效、无毒抗氧化剂,同时也是一种十分理想的天然药物^[3,4]。但茶多酚脂溶性较差,生物利用度低^[5,6],限制了其在医药和食品等行业的应用,同时也给从分子水平上研究茶多酚的药理学机制带来很多困难^[7]。目前,茶多酚的改性主要是使用化学合成的方法,改性后的茶多酚分子脂溶性虽然增强,但茶多酚在改性的过程中往往会损失部分酚羟基,导致茶多酚的生物活性大大降低。脂质体作为药物载体,具有有效保护被包裹药物、提高被包裹药物生物利用度、使被包裹药物具有靶向性和脂质体本身对人体无毒性及免疫抑制作用等优点^[8]。本实验采用脂质体包覆的方法,对茶多酚进行物理改性的研究。

1 材料和方法

1.1 药品与试剂:TP(成都辰龙绿色产业有限公司友情提供,质量分数大于 99%);大豆卵磷脂(上海聚源生物科技有限公司,生化试剂);胆固醇(上海伯奥生物科技有限公司,生化试剂);其他试剂均为分析纯。

1.2 仪器:旋转蒸发仪(上海申胜生物技术有限公司);KQ2200 超声波清洗器(昆山市超声仪器有限公司);LG10—2.4A 离心机(北京医用离心机厂);722S 分光光度计(上海精密科学仪器有限公司)。

1.3 脂质体的制备:用薄膜分散法制备。取适量磷脂和胆固醇,加入 30 mL 氯仿使之溶解,置于圆形烧瓶中,在 30℃下,减压蒸发,使脂质体在瓶内壁均匀成膜,抽干;配制含 TP 磷酸盐缓冲液 30 mL;将含 TP 的缓冲液加入圆形烧瓶中,轻轻振荡,充分溶

胀水合后(放置 3 d),超声波超声处理 10 min,即得脂质体。

1.4 脂质体与游离茶多酚的分离:采用离心法。

1.5 脂质体包封率的测定:将与脂质体分离后的游离 TP 上清液,用蒸馏水定容至 100 mL,采用分光光度法测定游离 TP 的量,按下式计算包封率。

包封率=(投入 TP 量-游离 TP 量)/投入 TP 量×100%

2 结果

2.1 标准曲线的制备:精确称取 TP 500 mg,溶于 100 mL 蒸馏水中,作为母液。分别吸取 2、4、6、8、10 mL 于 20 mL 量瓶中,加蒸馏水至刻度,得一系列对照品溶液。准确吸取各对照品溶液 1 mL 和酒石酸铁试剂 5 mL,置 25 mL 量瓶中,加 pH 7.5 的缓冲液至刻度。用水代替茶多酚作对照,在 540 nm 处测定吸光度(A)。用 A 与对应的质量浓度进行线性回归,得标准曲线方程 $A=0.3368C-0.0032$, $r=0.99996$,线性范围:0~2.5 mg/mL。

2.2 脂质体的处方设计:通过预试验分析确定,影响脂质体包封率的主要因素为卵磷脂与胆固醇质量比(A)、磷酸盐缓冲液 pH 值(B)和脂质体膜与 TP 质量(C)比等。采用正交试验来确定 TP 脂质体制备的最佳条件,因素与水平见表 1。

表 1 因素与水平

Table 1 Factors and levels

水平	因 素		
	A/(mg : mg)	B	C/(mg : mg)
1	500 : 400	6.0	180 : 900
2	600 : 300	6.5	112.5 : 900
3	675 : 225	7.0	90 : 900

2.3 正交试验方案与结果:按 $L_9(3^4)$ 安排试验,制

备脂质体,结果见表2。以茶多酚包封率为指标,进行直观分析,包封率的影响因素大小为 $B>A>C$,最优搭配为 $A_1B_1C_2$,故确定最优处方为磷脂500 mg,胆固醇400 mg,缓冲液pH值为6.0,茶多酚112.5 mg。

表2 $L_9(3^4)$ 正交试验结果Table 2 Results of $L_9(3^4)$ orthogonal test

试验号	A	B	C	包封率/%
1	1	1	1	59.72
2	1	2	2	28.95
3	1	3	3	9.87
4	2	1	2	57.46
5	2	2	3	9.54
6	2	3	1	11.22
7	3	1	3	37.59
8	3	2	1	10.56
9	3	3	2	8.37
K_1	32.847	51.590	27.167	
K_2	26.073	16.350	31.593	
K_3	18.840	9.820	19.000	
R	14.007	41.770	12.593	

2.3 验证试验:按优选处方,制备3批脂质体,茶多酚包封率分别为64.84%、65.31%和65.22%。

3 结论

本实验采用高纯度大豆卵磷脂和胆固醇为包封

材料,采用薄膜法制得茶多酚脂质体,方法简单、可行。通过预试验和正交试验,确定薄膜法制备茶多酚脂质体制备的最优处方磷脂500 mg,胆固醇400 mg,缓冲液pH值为6.0,茶多酚112.5 mg,所得茶多酚脂质体的包封率大于60%。

References:

- [1] Liu S X. Food Additives (食品添加剂) [M]. Beijing: China Petrochemical Press, 2001.
- [2] Gong C S. Extraction and application of tea polyphenol [J]. Mod Chem Eng (现代化工), 1999, 19 (3): 14-16.
- [3] Zhu Y W. Production and application of tea polyphenol [J]. Mod Chem Eng (现代化工), 1999, 19 (11): 31-33.
- [4] Jia Z S. Anti-oxidation and application of tea polyphenol [J]. Food Sci (食品科学), 1990, 19 (11): 1-5.
- [5] Lee M J. Analysis of plasma and urinary tea polyphenols in human subjects [J]. Cancer Epidemiol, 1995 (Biomarkers Prev. 4): 393-399.
- [6] Chow H H S. Phase I pharmacokinetic study of tea polyphenols following single dose administration of epigallocatechin gallate and polyphenol E [J]. Cancer Epidemiol, 2001 (Biomarkers Prev. 10): 53-58.
- [7] Lambert J D. Cancer chemopreventive activity and bioavailability of tea and tea polyphenols [J]. Mutat Res, 2003, 523/524: 201-208.
- [8] Chen J M. Development of liposome as medicine carrier [J]. J Pharm Pract (药学实践杂志), 2001, 19 (4): 214-218.

HPLC 法测定急咳停颗粒中麻黄碱和伪麻黄碱

严方, 赵陆华*, 卞祖薇

(中国药科大学 分析中心, 江苏 南京 210009)

急咳停颗粒为中药复方制剂,由黄芩、柴胡、蜜炙麻黄等10多味中药经特殊工艺加适量赋形剂研制而成,具有疏风清热、宣肺降气的功能,用于急性支气管炎等症的治疗。为了较全面控制制剂质量,除方中君药有定量指标外,本实验旨在再增加一味药的含量测定指标,麻黄为方中佐药,具有一定的功效,麻黄碱和伪麻黄碱为其主要有效成分,因此选为测定成分。因本品药味多,成分复杂,干扰较严重,若按文献报道的HPLC方法^[1~3],提取和测定两成分分离不理想。另由于本品为蜜炙麻黄入药,文献报道^[4],炮制品生物碱量下降26.62%,给测定造成困难。经色谱优化,样品处理方法考察,本实验建立

HPLC法同时测定了该制剂中麻黄碱和伪麻黄碱,方法专属性强,灵敏度高,重现性好,可作为本产品质量控制指标。

1 仪器与试剂

岛津LC—10ADvp泵,SPD—10ADvp紫外检测器,N-2000双通道色谱工作站;盐酸麻黄碱和盐酸伪麻黄碱对照品均购自中国药品生物制品检定所;急咳停颗粒剂由中国中医研究院实验厂提供;乙腈为色谱纯,其余试剂均为分析纯。

2 方法与结果

2.1 色谱条件:色谱柱:Hypersil C_{18} 柱(250 mm×4.6 mm, 5 μ m)(大连依利特仪器公司);流动相:

收稿日期:2004-09-17

作者简介:严方(1980—),女,河南人,中国药科大学分析测试中心硕士研究生,从事中药分析研究。Tel: (025) 83271185

* 通讯作者 赵陆华 Tel: (025) 83271560 E-mail: zhaoluhua@hotmail.com