

明显强于甘薯。

(刘 培摘)

304 P/O/P 乳剂蒸发法制备槲皮素微囊及其检测 [英]/Lee D H...//J Pharm Pharmacol. -2007, 59 (12). -1611~1620

黄酮类及相关化合物具有广泛的药理活性,但在水介质和常用的有机溶剂中稳定性和溶解性差。为解决此类问题,开发了一个新的方法,即以多元醇-油-多元醇(P/O/P)蒸发法制备黄酮类代表物质槲皮素的聚甲基丙烯酸甲酯(PMMA)微囊,分析了微囊的大小、包封效率,测定了微囊中的槲皮素,进行了体外释药实验,观察了该制剂的稳定性。

将 PMMA 溶于二氯甲烷,槲皮素溶于 1,3-丁二醇与甘油的混合液中[有时添加 1% 丙烯酸盐-C10-30 丙烯酸烷基酯聚合物(Pemulen TR-2)]。槲皮素悬浮液被乳化成 PMMA 二氯甲烷溶液[含亲脂性表面活性剂山梨聚糖倍半油酸盐(Arlacel 83)],作为初始多元醇-油(P1/O)乳剂。尔后 P1/O 再被乳化成含 1% 聚乙烯醇的 90% 甘油溶液,制备 P1/O/P2 乳剂。将 P1/O/P2 乳剂乳化、搅拌后蒸发至有机溶剂被完全除去,微囊用去离子化水洗、离心,冻干。油相中 PMMA 的浓度为 4%~12%,Arlacel 83 的浓度为 0.5%~4%。对微囊进行扫描电子显微镜观察,可见微囊为球形,无孔且表面光滑;其内醇相中是否有 Pemulen TR-2 对微囊外表面的形态特征无明显影响。在用含有 Pemulen TR-2 内醇相的微囊制备的 PMMA 微囊的截面图像中,其外表面光滑无孔,内部充满了亚微球。微囊的平均粒径约为 1.03~2.39 μm ,且随 PMMA 浓度增加,粒径轻微增加和微囊分布轻微扩大。而随 Arlacel 83 浓度的增加,粒径及粒径分布范围均减小。微囊的包封率为 12.7%~26.9%。体外释放实验表明,Pemulen TR-2 的加入能轻微减慢槲皮素的释放;释药动力学研究显示,含 Pemulen TR-2 微囊的释药行为符合扩散控制机制,而无 Pemulen TR-2 微囊的释药为不规则的扩散机制。此外,在 42 $^{\circ}\text{C}$ 储存条件下,游离槲皮素的量由于氧化原因,在 28 d 后可逐渐减少至 18%;而含有 Pemulen TR-2 的微囊中剩余的槲皮素的量可达 82%,表明微囊化对槲皮素的降解有明显抑制作用。以上结果表明 P/O/P 乳剂蒸发法可用于黄酮类化合物的包封。

(宁 娜摘 周 晶校)

305 在贯叶金丝桃组织培养物中贯叶金丝桃素和断贯叶金丝桃素的不同累积 [英]/Charchoglyan A...//Phytochemistry. -2007, 68(21). -2670~2677

贯叶金丝桃素(1)是贯叶金丝桃中的抗抑郁活性成分。从该植物体外培养物中发现了贯叶金丝桃素及 3 个相似的异戊烯基间苯三酚衍生物。这些化合物的累积与其植株再生有关。通过在线 LC-DAD、LC-MS、LC-NMR 法鉴定了贯叶金丝桃素同系物断贯叶金丝桃素(3)的结构。研究了植物激素和诱导剂对贯叶金丝桃组织培养物中化合物 1 与 3 比例的影响。

根据先前报道的方法建立愈伤组织和茎尖培养物。将它们置于 MS 培养基中使其生长。在高压灭菌处理后,加入植物激素贮备液。用于愈伤组织的培养基含萘乙酸(NAA);用于茎尖培养的介质中含 6-苄基腺嘌呤(BAP)。各类型培养物在置于旋转振荡器(80 r/min)上的 Erlenmeyer 烧瓶中,于 25 $^{\circ}\text{C}$ 、光照期 16 h 条件下培养。含 7~10 个嫩叶(簇)的培养物每隔 15 d 进行继代培养,较长的嫩叶被去除。诱导剂茉莉酮酸甲酯、甘露聚糖、酵母提取物在高压灭菌前加至培养基。LC-DAD 分析显示,茎尖培养物中含化合物 1、加贯叶金丝桃素(2)、化合物 3 和 adsecohyperforin(4)。愈伤组织培养物含少量化合物 1 和 3;而它们在形态培养物和茎尖培养物中水平较高,证明化合物 1 的形成依赖于体外培养物的再生水平。形态培养物中化合物 3 的量是化合物 1 的 3 倍;而茎尖培养物中化合物 3 的量与形态培养物中的相当,而化合物 1 的量高于化合物 3。诱导剂对愈伤组织培养物中化合物 1 和 2 的积累无影响,这很可能是由于在积累位点缺乏腺体结构的缘故;而形态和茎尖培养物中这两个化合物的量提高,且两者的量无显著差异。与对照组相比,经茉莉酮酸或茉莉酮酸甲酯处理后,化合物 1 的量提高了 2 倍,用甘露聚糖处理后能提高 3 倍;酵母提取物能同时抑制化合物 1 和 2 的合成。所有诱导剂均未引起形态培养物中化合物的变化。化合物 1 和 2 的比例明显受 BAP 和 NAA 的影响:提高 BAP 的浓度能刺激化合物 1 的合成,而提高 NAA 浓度,化合物 2 的量显著提高。总之,化合物 3 不单是化合物 1 生物合成的副产物,它们的产生与内源刺激密切相关,可能是在生物合成途径中的一个分支点上产生的。

(夏郭平摘)