

超微粉碎技术在中药制剂中广泛应用的优越性

李德成 刘庆燕

(山西生物应用职业技术学院, 山西省太原市民航南路 16 号, 030031)

关键词 超微粉碎; 优越性

超微粉碎技术是利用机械或流体动力的方法, 将物料颗粒粉碎至微米级甚至纳米级微粉的过程。根据粉碎力的原理不同, 超微粉碎可分为干法粉碎和湿法粉碎。中药超微粉碎主要是指中药材的细胞级超微粉碎, 细胞级中药超微粉碎是指以生物细胞破壁为目的的粉碎作业。通过超微粉碎, 能将原生材料的中心粒径从传统工艺的 150 ~ 200 目提高到 300 目以上, 对于一般药材, 在该细度条件下的细胞破壁率大于 95%^[1]。细胞经破壁后有效成分的释放速度及释放量会大幅度提高。超微粉碎由于是在封闭系统中进行操作, 不仅能保留传统饮片特色和优势^[2]; 还可避免煎煮带来的麻烦及对环境和产品的污染; 又能节省原料, 防止易挥发成分的损失; 能使升温后软化的药物易于粉碎, 还可将与细胞尺度相当的虫卵杀死, 改善了中药的卫生质量。超微粉碎过程为密闭过程, 利于环保, 对中药产业的长期和可持续发展起到了巨大作用^[3]。

1 改善了粉末的质感及均匀性, 提高临床应用能力

中药超微细粉的平均粒径一般在 10 μ m 以下, 甚至能达到更小的粒径要求水平, 其粉末细腻, 色泽一致, 使其均匀性有所提高, 并改变了传统粉碎方法粉碎后中药粉末质地粗糙、纤维与粉末分离均匀性差、花斑较多的现象, 提高了药物质量。邹艳敏^[4]发现: 甘草、丹参、黄连药材经超微粉碎, 粒径均匀, 并且有效成分含量较常规粉碎提高。

以粉体为原料的固体和半固体剂型, 采用超微粉碎技术制备后, 能改善这些剂型的品质和外观。金顺福等^[5]将薏苡仁和炒白术超微粉碎后直接入药制成颗粒剂, 制剂成型好, 无砂粒感。

吴玉生等^[6]通过临床观察发现: 水蛭微粉较水蛭粗粉更能有效地抑制脑梗死患者血管内皮损伤、血小板活化, 能提高脑梗死患者的临床疗效。劭陆^[7]采用体内抗菌实验研究芩连超微粉胶囊的抗菌作用, 发现药物浓度在 10g/kg 时即可降低染菌小鼠死亡率, 传统粉碎法制成的胶囊和片剂则无此效果。表明在一定剂

量下芩连超微粉胶囊有普通胶囊不具备的药理作用。

2 提高药物的生物利用度

从药理学原理来说, 药物的溶出速度与药物的颗粒比表面积呈正相关, 而比表面积与颗粒粒径成反比。研究发现超微粉碎可以明显降低粒径, 显著增强其比表面积, 使药物在胃肠道里的溶解度明显增加, 局部用药时的滞留性有所升高, 有利于延长药物与肠壁接触时间, 从而提高药物口服吸收的生物利用度^[8-9]。徐世军等^[10]采用小鼠耳片法、热板法研究蚁附蠲痹方的超微粉和颗粒剂 2 种剂型的抗炎、镇痛作用, 发现超微粉用量为颗粒剂的 1/2 时, 两者作用基本相似。侯集瑞等^[11]设计耐缺氧实验考察不同粒径的西洋参粉对延长小鼠耐缺氧能力的影响, 发现超微粉 (1 ~ 2 μ m) 延长百分率为 79.64%, 超微粉 (5 ~ 7 μ m) 延长百分率为 38.62%, 前者活性成分提高, 耐缺氧作用明显, 表明西洋参超微粉粒径不同提高药物活性的程度不同。

3 提高药物有效成分的溶出率, 增强药效

翟旭峰等^[12]对西洋参中有效成分的提取分离研究表明: 西洋参微粉中人参皂苷 Rb1 溶出的速度和程度均较细粉有明显的提高。税丕先等^[13]采用紫外分光光度法, 在 510nm 波长处测定吸光度, 结果发现皂角刺超微粉比细粉中总黄酮的提取率高 29.1%。李晓明等^[14]研究了超微粉碎对决明子大黄酚溶出量的影响, 结果发现溶出量增加, 浸出率可由原来的 7.6% 最大提高到 69.7%。张启明等^[14]对比考察了六味地黄细粉及超微细粉中熊果酸的含量和溶出特性, 结果发现在相同的测定条件下, 超微细粉中熊果酸含量较细粉高出 44.55%, 而且熊果酸释放速度及释放量均显著提高。刘迎等^[15]用蒽酮—硫酸法测定了黄芪、淫羊藿普通粉和超微粉对其多糖溶出量的影响。结果表明, 在相同的条件下, 超微粉中黄芪多糖、淫羊藿多糖提取量较普通粗粉分别提高了 117.13% 和 315.15%。

4 减少用药剂量, 使有限的中药资源得到充分利用

北京协和医院报道, 1 份粉末状决明子的润肺效果与 4 ~ 5 份粒状决明子等效, 金匱肾气丸超细粉碎后服用量由原来的 3g/丸减为 0.9g/丸, 且药效更强。司南等^[16]比较麻杏石甘汤超微粉与原饮片的有效成分

麻黄碱和伪麻黄碱溶出率,结果表明,前者 2 种有效成分含量高于后者,两者差异有统计学意义,表明微粉化确能减少用药剂量。中药经超微粉碎后,用较小剂量即可获得原处方的疗效,一般可节省药材 30% ~ 70%,微粉中药的丸散药给药剂量可减少到原来的 1/3 ~ 1/5,汤药给药剂量仅为原来的 1/5 ~ 1/20^[17]。

综上所述,超微粉碎技术既可以提高细胞破壁率、比表面积、有效成分溶出度、生物利用度,又能增强药理作用、减少用药量、节省药材和保护药材资源。但超微粉碎技术也存在一些问题,如超微粉碎药物粒度虽然可以尽量减小,而溶解度和溶解速度却不会无限地增大,粒度小到一定程度时表面能因素就显露出来,而且过细的粒子表面会吸附空气并带有电荷,从而影响药物吸收,增加药物存放难度。因此,将超微粉碎技术应用于中药基础研究时,只有确定具体品种的最适粒度,才能发挥其优势。其次,中药超微粉碎技术缺乏标准化、规范化的研究。近几年,中药超微粉碎技术可提高药效的理论正逐步被普遍认可,但要达到产业化和在临床上广泛应用,需要有相关成熟的标准来支持。生产工艺标准,检验和质量标准,超微粉碎粒径划定范围、目数标准等应尽快研究并逐步加以完善,以便用于指导生产。随着科学技术的发展和基础研究力度的加大,相信超微粉碎技术在中药制剂领域中所面临的这些问题会得到解决。

参考文献

- [1] 李富文,金凤媚.超微粉碎技术在中药业中的应用.中国动物保健,2003(11):35-36.
- [2] 张莉,于燕莉.超微粉碎技术及设备国内中药领域应用概述.实用医药杂志,2006,23(6):752-753.

- [3] 王玉蓉,杨玉芬,盖国胜.超微粉碎技术应用于中药领域的现状与展望.中国粉体技术,2008,14(2):72-76.
- [4] 邹艳敏.三种中药材微粉与普通粉松密度、流动性及有效成分含量的比较研究.时珍国医国药,2005,16(8):761-762.
- [5] 金顺福,刘美辉,濮存海.超微粉碎技术在仁术健胃颗粒剂中的应用.中成药,2005,27(1):15-18.
- [6] 吴玉生,张文高.水蛭微粉对急性脑梗死血管性假血友病因子、血小板 α -颗粒膜蛋白140水平的影响.山东中医药大学学报,2007,31(1):23-25.
- [7] 劭陆.超微粉碎对芩连胶囊药效学的影响.中成药,2005,27(8):976-978.
- [8] 俞忠明,戴诗文,寿旦,等.超微粉碎对白术中内酯成分体外溶出的影响.中国药房,2009,20(09):653.
- [9] 方琴.纳米技术在医药领域中的应用.贵州医学,2006,26(11):1040.
- [10] 徐世军,沈映君,解字环,等.蚁附罂粟颗粒和超细微粉的抗炎镇痛作用的比较.中药药理与临床,2005,21(4):55-57.
- [11] 侯集瑞,张慧珍,陈芳,等.西洋参超微粉对小鼠耐缺氧和抗疲劳作用的研究.吉林农业大学学报,2006,28(4):419-421.
- [12] 翟旭峰,张晨,郭晓蕾.西洋参超微粉与细粉中人参皂甙 Rb1 的溶出度比较研究.中药材,2009,32(2):290-292.
- [13] 税丕先,杨晓玲,何颖,等.皂角刺细粉与超微粉中总黄酮提取率的比较.中国药房,2009,20(12):920-921.
- [14] 刘树立,王华.超微粉碎技术的优势及应用进展.干燥技术与设备,2007,5(1):35-38.
- [15] 刘迎,史万玉,杨明,等.超微粉碎技术对黄芪多糖、淫羊藿多糖溶出率的影响.中西医结合杂志,2006,25(1):14-15.
- [16] 司南,杨健,边宝林.不同粒度麻杏石甘汤配方药材超微粉中麻黄碱与伪麻黄碱的溶出速率比较.中国中药杂志,2006,31(11):884-886.
- [17] 朱莉,隆泉,郑宝忠.超微粉碎技术及其在中药加工中的应用.云南大学学报(自然科学版),2004,26(增刊):130.

(2010-05-28 收稿)

《世界中医药》杂志简介

《世界中医药》杂志是由中华人民共和国国家中医药管理局主管,世界中医药学会联合会主办的国内外公开发行的科技综合性国际中医药学术期刊,由世界各国(地区)130 多名著名医学家、学科带头人组成编辑委员会和高级顾问组。《世界中医药》杂志已于 2006 年创刊,为双月刊,每月单月 16 日出版。杂志学术性强、权威性高,充分反映当今世界各国(地区)的中医药发展水平与导向,将全面促进全世界各国中医药科研、医疗、教学、医药流通与科学管理方面的交流合作,以本杂志为基础,采用新的管理模式,在世界多个国家,出版多种语言的文版,提高中医药从业者学术水平和服务能力,推动中医药的国际化发展,使中医药尽快地、堂堂正正地进入世界医疗卫生保健体系,更好地为全球人类健康服务。

地址:北京市朝阳区小营路 19 号财富嘉园 A 座 303 室,世界中医药杂志编辑部(100101);电话:010-58239055;传真:010-58239066;E-mail:wfems2006zss@163.com