

# 中药透皮剂的研究

黄建华 董韶昱<sup>a</sup> 董彩霞 王建国 姚锋娜

(河南科技学院化学化工学院制药工程 河南省新乡市华兰大道 453003)

<sup>a</sup>(河南省登封市中医院 河南省登封市 452470)

**摘 要** 透皮给药比口服和注射给药具有避免肝脏首过效应、避免胃肠道降解、避免皮肤损伤、释药速率稳定、血药浓度可控、毒副作用小、停药方便和给药频率低等优点, 利于长期治疗。本实验中中药组方成复方以水提醇沉法、回流法、浸渍法制得浸膏, 采用改良的 Franz 扩散装置, 以离体鸡皮为屏障生理盐水为接受介质, 用紫外分光光度法测定中药复方在不同条件下的吸光度, 来判断其透皮效果。结果表明, 回流法制得透皮剂浸膏的吸光度最大。回流法所制透皮剂渗透效果最佳, 随着时间的延长, 渗透效果不断加强, 其透皮效果明显优于水提醇沉法和浸渍法; 水提醇沉法和浸渍法所制透皮剂效果不显著。

**关键词** 透皮剂, 扩散, 渗透效果, 分光光度法。

中图分类号: O 657. 32

文献标识码: A

文章编号: 1004-8138(2009)01-0060-03

## 1 前言

透皮给药的原理主要是药物作用于表皮的角质层和活性表皮进入真皮被毛细血管吸收进入人体循环, 药物可破坏角质细胞间质, 造成角质层裂解剥落, 促使表皮细胞间隙增大, 从而降低皮肤对药物的阻滞作用, 利于药物经表皮细胞间隙透皮扩散。对于脂溶性较强的药物而言, 由于可以与角质层脂质相容, 细胞间类脂结构无疑是其渗透进入真皮层的最佳途径, 角质层的屏障作用较小, 其经皮渗透的主要限速因素是由角质层向生长表皮层的转运过程; 相反, 对于强极性的水溶性药物而言, 在角质层的扩散是它们的主要限速过程。另一种途径是通过毛囊, 皮脂腺和汗腺的吸收。当药物开始经皮渗透时, 因其通过皮肤附属器吸收的速度快于经过表皮吸收的速度, 所以药物先通过附属器途径吸收。当药物透过表皮途径到达血液循环后, 药物经皮渗透达到稳定, 此时附属器的吸收途径可以被忽略, 所以, 药物通过角质层的阶段是经皮吸收的决定阶段<sup>[1]</sup>。

中药复方是一个复杂的化学系统, 几乎包含各类化合物—强极性、中等极性、弱极性、挥发油类、大分子、金属离子和微量元素等, 如何从中提取、分离有效成分并确定其药效是研究主题。

## 2 实验部分

### 2.1 主要仪器和试剂

透皮扩散装置(自制); UV-1100 型紫外分光光度仪(北京瑞利分析仪器有限公司); GSY-II 型恒温水浴锅(北京市医疗设备厂); 氯化钠(天津市化学试剂三厂); 无水乙醇(洛阳化学试剂厂); 吐温-80(洛阳化学试剂厂); 试剂均为分析纯。实验用水为蒸馏水。

联系人, 电话: (0373) 3040567; E-mail: dongcx@tom.com

作者简介: 黄建华(1954—), 男, 安徽省萧县人, 教授, 长期从事生化制品的制备和技术研究。

收稿日期: 2008-04-10; 接受日期: 2008-05-25

## 2.2 提取方法

### 2.2.1 水提醇沉法

按照配方称八味中草药共 40g, 加水 480mL 浸泡大约 40min, 加热煎煮 30min, 冷却后滤出煎煮液后再加水 400mL 煎煮约 30min, 合并两次滤液, 脱脂棉纱布过滤, 得 200mL 提取液, 加入无水乙醇, 使含醇量达到 60%, 搅拌均匀放置 12h 后, 除去沉淀和絮状物, 取上清液用旋转蒸发仪浓缩至无醇味, 回收乙醇, 在浓缩液中加入 2mL 吐温-80, 搅匀, 充分静置, 收集上清液备用。

### 2.2.2 回流提取法

取 40g 中药用滤纸卷成筒状放入索氏提取器中, 加 480mL 无水乙醇, 连续回流 5h 使药物的有效成分充分浸出, 得提取液约 350mL, 用旋转蒸发仪回收乙醇, 使其浓缩至膏状, 放入冰箱备用。

### 2.2.3 浸渍法

取中药 40g 放入洗净的烧杯中, 加入 480mL 水, 用保鲜膜封口, 浸泡 2—3 天, 使有效成分充分浸出。用 4 层纱布过滤。备用。

## 2.3 透皮吸收实验

### 2.3.1 离体鸡皮的制备

取健康的鸡, 处死后立即剃毛, 小心剥离翅膀下羽毛少、毛孔细的皮肤, 除去皮下脂肪, 用纯净水反复冲洗干净, 再用 0.9% 的生理盐水冲洗几遍, 浸于 0.9% 的生理盐水中, 置冰箱中保存备用<sup>[2]</sup>。

### 2.3.2 透皮扩散装置的准备

见图 1。

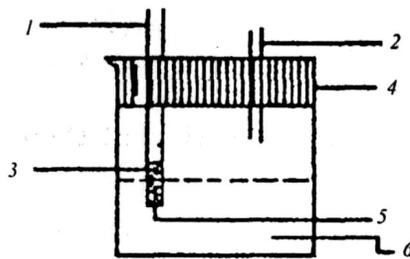


图 1 透皮吸收装置

1——样品池; 2——取样口; 3——供试液;  
4——接受池; 5——离体鸡皮; 6——接受液。

此装置是用直径 10mm 的玻璃管作为样品池, 用 500mL 的烧杯作为接受池, 两池之间固定皮肤。将预处理好的皮肤置于玻璃管下端 (面积 2cm × 2cm) 用细线固定, 角质层朝上。接收池内盛 0.9% 的生理盐水为接收液, 并保证释放液和接收液的液面持平, 使皮肤与接收液面充分接触。将透皮吸收装置置于 37℃ 恒温水浴锅中保温<sup>[3]</sup>。

### 2.3.3 测定最大吸收波长<sup>[4]</sup>

取水提醇沉法所得透皮剂 0.1mL, 用生理盐水定容至 100mL 容量瓶, 同时以生理盐水为空白, 用 UV-1100 型紫外分光光度仪在 200—400nm 范围内扫描的紫外吸收光谱。结果指出, 在波长 223nm 处有最大吸收峰。

### 2.3.4 透皮扩散实验<sup>[5,6]</sup>

按装置图 1 所示,将离体鸡皮固定于样品池下端,管内分别加入 2mL 以各种方法制得的中药透皮剂,接受池中加 200mL 生理盐水,使鸡皮与接受液液面接触。在连续搅拌下于 37 的水浴中恒温,分别于 1、2、3、4、5h 后取接受池中扩散液 5mL (同时补充生理盐水 5mL),以生理盐水为空白,于波长 223nm 处测定吸光度。

## 3 结果

结果见表 1。

表 1 不同时间的吸光度

制备方法	1h	2h	3h	4h	5h
水煮醇沉法	0.268	0.453	0.602	0.606	0.761
回流法	0.688	0.835	0.828	0.855	0.859
浸渍法	0.202	0.367	0.628	0.630	0.766

## 4 结论

结果显示用不同的方法制得的中药透皮剂在皮肤上均有渗透作用。回流法所制透皮剂渗透效果最佳,随着时间的延长,渗透效果不断加强,它明显优于水提醇沉法和浸渍法;水提醇沉法和浸渍法所制透皮剂渗透效果不显著。

## 参考文献

- [1] 李宝红 促透剂在透皮吸收制剂中的应用概况[J]. 广东医药, 2004, 14(3): 25—27.
- [2] 陆锦芳 透皮促渗剂对氧氟普胺的透皮吸收[J]. 上海医药大学学报, 1994, 5(3): 205—206.
- [3] 安凤山 氮酮对替硝唑搽剂促透皮吸收作用的实验研究[J]. 山东医药工业, 2001, (4): 4—5.
- [4] 刘荣 不同浓度的月桂氮酮对双氯芬酸钠凝胶剂透皮吸收的影响[J]. 华西医学杂志, 2004, 19(4): 269—270.
- [5] 徐贵丽 白胶香挥发油对替硝唑透皮吸收促进作用的研究[J]. 广东药学院学报, 2004, 20(6): 617—618.
- [6] 欧阳淑媛 皮肤给药助渗剂氮酮的合成研究[J]. 湖南化工, 1998, 6(28): 28—30.

## Study on Chinese Herbal Penetration

HUANG Jian-Hua DONG Shao-Yu<sup>a</sup> DONG Cai-Xia WANG Jian-Guo YAO Feng-Na  
 (Pharmacy Engineer, Department of Chemistry and Chemical Industry, Henan Institute of Science and Technology,  
 Xinxiang, Henan 453003, P. R. China)  
<sup>a</sup>(The Chinese Medicine Hospital, Dengfeng, Henan 452470, P. R. China)

**Abstract** Compared to oral and injected drug delivery, transdermal drug delivery has roles on avoiding liver head leading effect bowel dedine and skin hurting, which is stable and controllable on releasing medicine velocity and blood medicine density and less side effect, and beneficial to cure over a long period of time and improving the sufferer's adaptability with transdermal drug delivery. The desiccant extracts were made by ethanol precipitation, reflux and immerse method from Chinese herbal medicine compound prescribe. The *in vitro* penetration diffusion was studied using improved Franz equipment and chick skin, sodium chloride injections were employed in the receptor compartments absorbance of Chinese herbal medicine compound prescribe was monitored by UV-spectrophotometry.

**Key words** Penetration, Diffusion, Penetration Effect, Spectrophotometry.