



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 103622910 A

(43) 申请公布日 2014. 03. 12

(21) 申请号 201210311379. 9

(22) 申请日 2012. 08. 29

(71) 申请人 奇复康药物研发(苏州)有限公司

地址 215125 江苏省苏州市工业园区星湖街
218 号 A2-315

(72) 发明人 沈金辉

(51) Int. Cl.

A61K 9/127(2006. 01)

A61K 9/19(2006. 01)

A61K 31/56(2006. 01)

A61P 35/00(2006. 01)

权利要求书1页 说明书2页

(54) 发明名称

一种白桦酸脂质体制备方法

(57) 摘要

本发明揭示了一种白桦酸脂质体制备方法,包含以下组分及重量百分比:白桦酸 18%~25%,卵磷脂或大豆磷脂 18%~23%,胆固醇 18%~25%,甘露醇 35%~45%,本发明将白桦酸制成脂质体制剂,解决了低水溶性对药效发挥的影响,工艺简单,生产方便。

1. 一种白桦酸脂质体制备方法,其特征在于包含以下组分及重量百分比:

白桦酸 18%~25%

卵磷脂或大豆磷脂 18%~23%

胆固醇 18%~25%

甘露醇 35%~45%

2. 根据权利要求1所述的一种白桦酸脂质体制备方法,其特征在于包括如下步骤:

步骤一,称取处方量的白桦酸,卵磷脂和胆固醇于蒸发容器中,加入乙醇至完全溶解,加入防爆玻璃珠,于旋转蒸发仪上 25 ~ 35 摄氏度蒸干成膜,真空干燥至容器中无醇味;

步骤二,加入磷酸盐缓冲液将膜荡洗下来,在超声仪中超声 20 ~ 30 分钟使膜溶解,过 0.45 微米滤膜;

步骤三,称取处方量甘露醇,以水合介质加水溶解,放置于容器中,加入步骤二所得滤液,充分分散,倒入乳匀机,在一级阀 1760Bar,二级阀 270Bar 的压力下,连续乳匀 5 次,冷冻干燥或喷雾干燥得到粉针剂。

一种白桦酸脂质体制备方法

技术领域

[0001] 本发明涉及中药制剂领域,尤其一种白桦酸脂质体制备方法。

背景技术

[0002] 白桦酸作为一种广谱的抗肿瘤药物已经多见报道,本发明方法的原料药白桦酸来源于梧桐树的树皮,其药理价值极高,但是其极低的水溶性,在用药的时候带来了极大的不便,不能做成水针剂,使得治疗效果受到影响。

发明内容

[0003] 鉴于上述现有技术存在的缺陷,本发明的目的是提出一种白桦酸脂质体的制备方法,解决白桦酸在水中溶解度低带来的影响。

[0004] 本发明的目的将通过以下技术方案得以实现:

[0005] 一种白桦酸脂质体制备方法,包含以下组分及重量百分比:

[0006]

白桦酸	18%~25%
卵磷脂或大豆磷脂	18%~23%
胆固醇	18%~25%
甘露醇	35%~45%

[0007] 该制备方法包括如下步骤:

[0008] 步骤一,称取处方量的白桦酸,卵磷脂和胆固醇于蒸发容器中,加入乙醇至完全溶解,加入防爆玻璃珠,于旋转蒸发仪上 25 ~ 35 摄氏度蒸干成膜,真空干燥至容器中无醇味;

[0009] 步骤二,加入磷酸盐缓冲液将膜荡洗下来,在超声仪中超声 20 ~ 30 分钟使膜溶解,过 0.45 微米滤膜;

[0010] 步骤三,称取处方量甘露醇,以水合介质加水溶解,放置于容器中,加入步骤二所得滤液,充分分散,倒入乳匀机,在一级阀 1760Bar,二级阀 270Bar 的压力下,连续乳匀 5 次,冷冻干燥或喷雾干燥得到粉针剂。

[0011] 本发明的突出效果为:

[0012] 将白桦酸制成脂质体制剂,解决了低水溶性对药效发挥的影响,工艺简单,生产方便。

具体实施方式

[0013] 下面通过具体实施例对本发明的方法进行说明,但本发明并不局限于此。下述实

施例中所述实验方法,如无特殊说明,均为常规方法;所述试剂和材料,如无特殊说明,均可从商业途径获得。

[0014] 实施例:

[0015] 本实施例一种白桦酸脂质体制备方法,包含以下组分及重量百分比:

[0016]

白桦酸	18%~25%
-----	---------

卵磷脂或大豆磷脂	18%~23%
----------	---------

胆固醇	18%~25%
-----	---------

甘露醇	35%~45%
-----	---------

[0017] 该制备方法包括如下步骤:

[0018] 步骤一,称取处方量的白桦酸,卵磷脂和胆固醇于蒸发容器中,加入乙醇至完全溶解,加入防爆玻璃珠,于旋转蒸发仪上 25 ~ 35 摄氏度蒸干成膜,真空干燥至容器中无醇味;

[0019] 步骤二,加入磷酸盐缓冲液将膜荡洗下来,在超声仪中超声 20 ~ 30 分钟使膜溶解,过 0.45 微米滤膜;

[0020] 步骤三,称取处方量甘露醇,以水合介质加水溶解,放置于容器中,加入步骤二所得滤液,充分分散,倒入乳匀机,在一级阀 1760Bar,二级阀 270Bar 的压力下,连续乳匀 5 次,冷冻干燥或喷雾干燥得到粉针剂。

[0021] 载药率检测方法:使用高效液相色谱检测,分析方法:采用安捷伦 C18 柱 (250×4.6mm,5 μm);流动相为乙腈-水 (85 : 15);流速为 0.8ml·min⁻¹;柱温为室温;检测波长为 212nm。

[0022] 采用过膜法测定载药率。精密称取卵磷脂 0.300g 和胆固醇 0.300g 置于梨形瓶中,加入 20ml 乙醇 (其中含有白桦酸 0.01g),振摇,加入 10 颗玻璃珠,于旋转蒸发仪上 30℃、50rpm 旋转蒸干成膜,真空干燥,直到梨形瓶中无乙醇味,加入磷酸缓冲盐溶液 10ml (pH = 6.8、0.05mol/L),将膜荡洗下来,在超声仪中超声 30min,使膜乳化成脂质体,过 0.45 μm 无机相滤膜,即得。

[0023] 应用过滤法测定载药率的公式为:

[0024] 载药率 (%) = (过膜后的药物峰面积 / 过膜前的药物峰面积) × 100%

[0025] 最后经过测定药物载药率在 90% 以上。

[0026] 本实施例的突出效果为:

[0027] 将白桦酸制成脂质体制剂,解决了低水溶性对药效发挥的影响,工艺简单,生产方便。

[0028] 本发明尚有多种实施方式,凡采用等同变换或者等效变换而形成的所有技术方案,均落在本发明的保护范围之内。