

微晶纤维素与抗菌剂复合体解吸条件及其释放量*



王福祥¹, 恩·柯捷里尼可娃², 侯永发^{1*}, 恩·鲁吉娜²

- (1. 中国林业科学研究院 林产化学工业研究所, 江苏 南京 210042;
2. 俄罗斯科学院 高分子化合物研究所, 俄罗斯 圣彼德堡 197198)

WANG F X

摘 要: 实验表明, 微晶纤维素(MCC)对卡达波尔(抗菌剂)的吸附量与卡达波尔原始浓度 C_0 有关, 即 C_0 越高, 吸附量越大。木浆 MCC 吸附量高于其它种类。另外, 模拟人体肠胃(消化)系统生理过程条件, 研究了不同种类 MCC-卡达波尔复合体解吸状况。结果表明, 在 pH 值 2.0(相当于人体胃内条件)时, 解吸程度最大(63.1%~73.7%); 在 pH 值 9.0(相当于人体肠内条件)时, 尚能继续补充解吸。两段解吸总量达 70%~90%。证明该复合体可以作为胃肠药剂, 用于实践发挥疗效。

关键词: 微晶纤维素; 抗菌剂; 复合药物

中图分类号: TQ352

文献标识码: A

文章编号: 0253-2417(2004)S0-0123-03

DESORPTION CONDITION AND DESORPTION AMOUNT OF MICROCRYSTALLINE CELLULOSE(MCC)-ANTIBIOTIC COMPLEX

WANG Fuxiang¹, KOTELNIKOVA N E², HOU Yongfa¹, ZAIKINA N D²

- (1. *Institute of Chemical Industry of Forest Products, CAF, Nanjing 210042, China;*
2. *The institute of Macromolecule Compounds of Russian Academy, St. Petersburg 197198, Russia*)

Abstract: Result of experiment shows: the adsorption amount of microcrystalline cellulose (MCC) for catapol (antibiotic) is related with catapol's original concentration (C_0). The higher C_0 is, the more adsorption of MCC is. The adsorption amount of wood pulp MCC is higher than others. By imitating the physiological condition of human stomach intestine system (digestive system), we studied the adsorption and desorption of different kinds of the complex MCC-catapol. The result shows that at pH value 2.0 (equivalent to the condition in the stomach of human body), the desorption level arrived the max (63.1% - 73.7%); at pH value 9.0 (equivalent to the condition in the intestines of human body), the complex which desorbed at pH value 2.0 can still desorb continuously. Total desorption amounts of these two stages reach 70% - 90%, which proved that the complex could be used as stomach-intestines medicament.

Key words: microcrystalline cellulose(MCC); antibiotic; compound medicine

在开展的“以微晶纤维素为载体吸附生物活性物及其解吸”系列研究项目中, 曾确定以模拟人体肠胃系统消化生理过程的条件, 研究不同种类微晶纤维素与抗菌剂聚合物卡达波尔之间吸附-解吸作用

* 收稿日期: 2003-05-09

基金项目: 国家自然科学基金委员会资助国际合作项目(39811121329)

作者简介: 王福祥(1974-), 男, 江苏丰县人, 助研, 硕士, 主要从事天然植物生物制药研究。

* 通讯联系人

为主要任务。以4种微晶纤维素为载体,进行对卡达波尔的吸附-解吸作用研究,找出在不同pH值下的吸附与解吸规律。

1 实验部分

1.1 主要原料

1.1.1 微晶纤维素(MCC) 4种不同种类(棉浆、木浆、蔗渣浆、苇浆)的微晶纤维素(MCC)均由中国林科院林产化学工业研究所制备^[1]。

1.1.2 抗菌剂卡达波尔(Catapol) 由俄罗斯圣彼德堡Pharmacon制药厂生产。

1.2 实验方法

1.2.1 吸附 将卡达波尔稀释至0.1%~10%的溶液,量取5 mL溶液,加入装有0.1 g MCC的称量瓶中,在一定温度下搅拌5 min至6 h,所得分散液用4号玻砂漏斗过滤、抽滤,然后在40 °C条件下真空干燥至恒重。

1.2.2 解吸 称取一定量的试样加入5 mL不同pH值缓冲液的称量瓶中,控制温度在20 °C,经过一定时间后,用4号玻砂漏斗抽滤,在40 °C下真空干燥至恒重。

2 结果与讨论

2.1 不同MCC对卡达波尔的吸附量A的影响

不同MCC对卡达波尔吸附实验按文献所述工艺条件进行^[1-2]。卡达波尔原始浓度 C_0 为30和50 mg/mL(MCC与卡达波尔摩尔比为1:25)的实验结果见表1。

由表1数据可知,A值大小与 C_0 相关,即 C_0 越高,A值越大。这证明了前期研究^[3-4]的结果。此外,实验数据还表明:木浆MCC的A值在相同条件下高于其它3种MCC。

2.2 pH值对卡达波尔解吸的影响

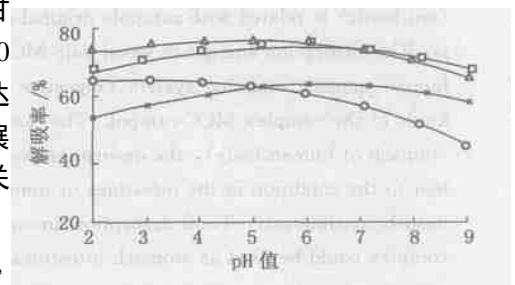
MCC与卡达波尔复合体的微生物活性决定于卡达波尔向周围介质的解吸能力。在pH值为2.0、6.0、8.0和9.0的缓冲液中进行了复合体的解吸实验,用甘氨酸溶液作为pH值2.0的缓冲液,磷酸溶液作为pH值6.0和8.0的缓冲液,硼酸溶液作为pH值9.0的缓冲液。取卡达波尔含量为180~320 mg/g的复合体作为解吸试样。图1展示了4种MCC与卡达波尔复合体解吸量与pH值的相互关系。

由图1曲线可看出,在所有pH值条件下,解吸量都较高,并且达到了55%~70%。其中,蔗渣浆MCC复合体和棉浆MCC复合体在pH值2.0时,有较低解吸率。在pH值2.0(相当于人体胃内条件)和9.0(相当于肠内条件)下相继解吸,进行人体消化系统的生理过程模拟实验,结果见表2。

从表2数据可知,所有试样在pH值2.0时的解吸程度最大。但在pH值9.0时,卡达波尔尚能继续进行补充解吸。两次相继解吸总量均大于每段解吸量。这个重要结论对于实际应用极为重要。

表1 不同MCC对卡达波尔的吸附量(A)

微晶纤维素种类 types of MCC	吸附量 adsorption amount(A)/(mg/g)	
	$C_0=30\text{ mg/mL}$	$C_0=50\text{ mg/mL}$
棉浆 cotton pulp	145.4	214.4
木浆 wood pulp	189.2	471.4
蔗渣浆 bagasse pulp	37.1	311.5
苇浆 reed pulp		289.2



—○—苇浆MCC reed pulp MCC, A 309.2 mg/g;
—△—木浆MCC wood pulp MCC, A 471.3 mg/g;
—×—蔗渣浆MCC bagasse pulp, A 313.2 mg/g;
—□—棉浆MCC cotton pulp MCC, A 222.1 mg/g

图1 pH值与不同种类MCC-卡达波尔复合体解吸率的关系

Fig. 1 Relation between pH value and desorption ratio of different MCC-Catapol complex

表 2 复合体在 pH 值 2.0 和 9.0 条件下的相继解吸结果

Table 2 Desorption of Catapol by complex at pH values 2.0 and 9.0

复合体种类 complexes	吸附量 $A / (\text{mg} \cdot \text{g}^{-1})$ Catapol adsorbed	解吸量 $D^{1)}$ catapol desorbed/ %		残留卡达波尔量/ % ²⁾ residual Catapol	解吸卡达波尔量/ % ²⁾ total Catapol desorbed
		pH 2.0	pH 9.0		
棉浆 MCC 与卡达波尔 cotton pulp MCC & Catapol	222.2	63.1	46.2	19.9	80.1
木浆 MCC 与卡达波尔 wood pulp MCC & Catapol	471.2	73.4	13.6	23.0	77.0
蔗渣浆 MCC 与卡达波尔 bagasse MCC & Catapol	313.2	63.1	15.5	31.0	69.0
苇浆 MCC 与卡达波尔 reed pulp MCC & Catapol	309.2	73.7	69.9	7.9	92.1

1) D 值系 pH 值 9.0 时的解吸值(pH 值 2.0 时 D 以解吸后所剩卡达波尔计); 2) 对吸附量计。

3 结论

3.1 微晶纤维素(MCC)对生物活性物质卡达波尔(Catapol)的吸附量与卡达波尔原始浓度 C_0 有关,即 C_0 越高吸附量(A)越大。另外,不同种类的 MCC 复合体的吸附量不尽相同,其中木浆 MCC 的吸附量高于其它种类。

3.2 两次相继解吸作用导致卡达波尔从复合体内解吸能力提高。

3.3 模拟人体肠胃系统的生理过程进行解吸表明,所制备的 MCC 与卡达波尔的复合体能够分别在胃与肠内进行两段解吸释放出生物活性物卡达波尔,从而证明其具有医疗效用。

参考文献:

- [1] 侯永发, 等. 不同种类微晶纤维素对抗菌素卡达波尔吸附特点的对比研究[J]. 纤维素科学与技术, 1997, 7(2): 48-59.
- [2] KOTELNIKOVA kova N E, *et al.* Cellulose materials modified by antiseptics and their antimicrobail properties[J]. J Polymers in Medicine(Poland), 1998, 38(3-4): 37-53.
- [3] KOTELNIKOVA N E, HOU Y F, ZAIKINA N A, *et al.* Modification of cellulose materials by antiseptics and their antimicrobial properties(I). ——Adsorption of antiseptics of cellulose materials[J]. 林产化学与工业, 1999, 19(3): 53-59.
- [4] KOTELNIKOVA N E, HOU Y F, PANARIN E F, *et al.* Modification of cellulose materials by antiseptics and their antimicrobial properties(II). ——Release of antiseptics from modified cellulose materials and their antimicrobial activity[J]. 林产化学与工业, 2000, 20(4): 45-49.