# 探討生物活性物質經由奈米乳液遞送系統改善口服生物利用性

林易霆（5116）

12/08/2021

## 大綱

一、前言
二、以奈米乳液作為提高穿心蓮內酯口服生物利用度和抗發炎活性的策略
三、丹皮酚奈米乳液提高口服生物利用度：優化與機制
四、以磷脂複合物製備奈米乳液系統用於口服胰島素之遞送：製備、體外和體內評估
五、結論

## 摘要

現今常見的給藥途徑有靜脈注射、肌肉注射、皮下注射等方法，不過疼痛、局部過敏反應等不適症狀與副作用時常導致患者依從性低，然而部分藥物之主成分卻因其水溶性低、穩定性差或是 P-糖蛋白 (P-glycoprotein, P-gp) 對於藥物的限制吸收而導致其口服投藥成效不佳。其中 P-gp 的外排效應常常是造成口服投藥吸收效果不佳的主要原因。因此找出有效的藥物遞送載體成為口服投藥的關鍵。在製藥工業中，奈米乳液 (Nanoemulsion, NE) 已廣泛作為藥物遞送系統以保護活性成分之有效性與避免主成分受極端條件導致氧化、水解和揮發。NE 被證實可通過不同的吸收途徑提高藥物口服生物利用度之有效載體，其能夠改善藥物之水溶性與穩定性、促進淋巴輸送、增強腸道通透性、預防 P-糖蛋白 (P-glycoprotein, P-gp) 對藥物成分的排出，有助於提高藥物的口服生物利用度。故本篇報告旨在探討應用奈米乳液作為遞送系統改善生物活性物質之口服利用性。綜合三篇文獻之結果，奈米乳液可有效地改善穿心蓮內酯 (Andrographolide, AG)、丹皮酚 (Paeonol, Pae)、胰島素等溶解度低、穩定性差之生物活性物質口服生物利用性，其中 AG、Pae 包覆於 NE 系統後更是相比其懸浮液組提升了 6 倍與 4 倍之口服生物利用度。另一方面，胰島素也藉由磷脂複合技術將原先只存在水相中的胰島素，成功地負載至 NE 油相中，且還能維持胰島素之正常生物活性，特別在於 W/O NE 系統中更是具有持續且顯著的降血糖作用和更加的口服生物利用性。此外，NE 也被證實能夠顯著地降低 P-gp 外排效應，是克服藥物口服吸收限制與障礙的有效載體，顯示出奈米乳液具有作為口服生物活性物質遞送系統之應用潛力。

# 參考文獻

**Yen, C. C., Chen, Y. C., Wu, M. T., Wang, C. C., & Wu, Y. T.** (2018). Nanoemulsion as a strategy for improving the oral bioavailability and anti-inflammatory activity of andrographolide. *International journal of nanomedicine*, *13*, 669.

**Chen, S., Zhang, J., Wu, L., Wu, H., & Dai, M.** (2018). Paeonol nanoemulsion for enhanced oral bioavailability: optimization and mechanism. *Nanomedicine*, *13*(3), 269-282.

**Hu, X. B., Tang, T. T., Li, Y. J., Wu, J. Y., Wang, J. M., Liu, X. Y., & Xiang, D. X.** (2019). Phospholipid complex based nanoemulsion system for oral insulin delivery: preparation, in vitro, and in vivo evaluations. *International journal of nanomedicine*, *14*, 3055.