

维生素 E 及其琥珀酸酯和琥珀酸钙 在保健食品中的应用

李春波^{*}, 邵斌

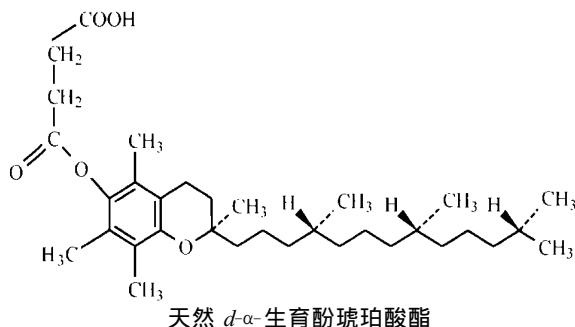
(浙江医药股份有限公司新昌制药厂, 新昌 312500)

【摘要】介绍了天然维生素 E 琥珀酸酯和维生素 E 琥珀酸钙(天然/合成)的理化性质、在保健食品中的应用优点以及它们独特的抗癌保健功能。维生素 E 琥珀酸酯和琥珀酸钙在欧美日等发达国家已得到广泛的应用,几乎所有的片剂和胶囊剂营养补充剂中使用的维生素 E 均为维生素 E 琥珀酸酯和琥珀酸钙,而在国内则是空白,因而在新一代保健食品中具有十分广阔的应用前景。

【关键词】生育酚; 天然维生素 E 琥珀酸酯; 天然维生素 E 琥珀酸钙; 合成维生素 E 琥珀酸钙; 抗癌

【中图分类号】 R977.2⁺5 **【文献标识码】** A **【文章编号】** 1000-5048(2003)02-0190-03

传统的维生素 E 如天然 *d*-α-生育酚、合成 *dl*-α-生育酚、天然 *d*-α-生育酚醋酸酯和合成 *dl*-α-生育酚醋酸酯等均为粘油状物,制作软胶囊疗效很好,但在制作片剂、硬胶囊工艺上遇到了麻烦。有一种方法是将油状维生素 E 通过微囊化喷雾干燥制成干粉类产品可方便地添加到固体食品或乳制品中作营养强化剂或抗氧化剂使用,但用于制作片剂和硬胶囊,特别是与其它抗氧化剂成分如维生素 C、β-胡萝卜素或植物提取物等固体成份配合使用时,效果并不十分理想。普遍存在的问题有如单位重量产品的生物活性低、片剂和胶囊占用体积大、易吸潮、易染菌、不易压片等。天然维生素 E 琥珀酸酯(又称天然 *d*-α-生育酚琥珀酸酯)和维生素 E 琥珀酸钙(天然/合成)应运而生,该两类产品常态下均为固体粉末,前者 mp. 73~78 ℃,后者 mp. 180~185 ℃,很好地解决了干粉类产品用于制作片剂和硬胶囊的不足之处,在保健食品领域具有十分广阔的应用前景。



1 理化指标

1.1 天然维生素 E 琥珀酸酯

天然维生素 E 琥珀酸酯的理化性质见表 1。

表 1 天然维生素 E 琥珀酸酯的理化性质

项 目	指 标
含量	96.0%~102.0%
酸度	18.0~19.3 ml
重金属(以 Pb 计)	≤10 mg/kg
堆积密度	0.45~0.60 g/(cm) ³
比旋度	≥+24°
熔点	73~78 °C

1.2 合成维生素 E 琥珀酸钙

合成维生素 E 琥珀酸钙的理化性质见表 2。

表 2 合成维生素 E 琥珀酸钙的理化性质

项 目	指 标
含量	96.0%~102.0%
氯化物(%)	≤0.212
吸收系数 $E_{\text{cm}}^{1\%}$ 286 nm	36.0~40.0
重金属(以 Pb 计)	≤20 mg/kg
砷(以 As 计)	≤2 mg/kg
干燥失重	≤2.0%
熔点	180~185 °C

2 生物活性单位换算

维生素 E 的定义非常广泛,包括生育酚和生育三烯酚等天然存在的化合物,还包括合成维生素

* 【收稿日期】 2002-11-26 * 【通讯作者】 Tel: 0575-6022746

?1994-2015 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved. http://www.cnki.net

E 以及天然和合成 α -生育酚的衍生物如醋酸酯、琥珀酸酯、琥珀酸钙、水溶性维生素 E 等, 它们的生物活性和功效存在较大差异, 因而提出“维生素 E 族”的概念。维生素 E 族成员的生物活性一般以国际单位(IU)或 α -生育酚当量(α -TE)表示。国际单位(IU)的定义是 1 mg 合成 dl - α -生育酚醋酸酯的生物活性为 1 IU; α -生育酚当量(α -TE)的定义是 1 mg 天然 d - α -生育酚的生物活性为 1 α -生育酚当量(α -TE); 1α -TE = 1.49 IU。几种常见的维生素 E 的生物活性单位换算如下:

$$\begin{aligned} 1 \text{ mg 天然 } d\text{-}\alpha\text{-生育酚醋酸酯} &= 1.49 \text{ IU} = 1 \alpha\text{-TE} \\ 1 \text{ mg 天然 } d\text{-}\alpha\text{-生育酚琥珀酸酯} &= 1.21 \text{ IU} = 0.81 \alpha\text{-TE} \\ 1 \text{ mg 合成 } dl\text{-}\alpha\text{-生育酚琥珀酸钙} &= 0.85 \text{ IU} = 0.57 \alpha\text{-TE} \\ 1 \text{ mg 天然 } d\text{-}\alpha\text{-生育酚醋酸钙} &= 1.168 \text{ IU} = 0.78 \alpha\text{-TE} \end{aligned}$$

3 固体维生素 E 的优点

在健康食品中使用天然 d - α -生育酚琥珀酸酯和维生素 E 琥珀酸钙(天然/合成)有诸多优点, 目前已成为欧美国家维生素类保健食品中应用最普遍的原料。

3.1 单位重量产品的生物活性高

通过微囊化喷雾干燥而得的维生素 E 水分散性干粉, 由于囊材包油率的限制, 一般最高含量只能达到 50%, 因此会占用比较大的片剂和胶囊体积。表 3 所示的是某种含 100 mg 维生素 E 的健康食品, 各种固体类维生素 E 和干粉类维生素 E 所需的用量。

表 3 某种健康食品中各种维生素 E 的含量

产品	活性		剂量 (mg)
	α -TE g	IU/g	
合成维生素 E 醋酸酯干粉 50%	335	500	300
天然维生素 E 醋酸酯干粉 700 IU/g	470	700	212
天然维生素 E 琥珀酸酯	812	1210	123
天然维生素 E 琥珀酸钙	784	1168	128
合成维生素 E 琥珀酸钙	570	850	175

3.2 熔点高, 可耐受任何条件的压制和造粒

天然 d - α -生育酚琥珀酸酯的 mp. 为 73~78 °C, 维生素 E 琥珀酸钙的 mp. 180~185 °C, 完全可以满足片剂和硬质胶囊的加工工艺要求。

3.3 稳定性好、不易吸潮、不易染菌

由于 α -生育酚 6 位活性基团酚羟基被琥珀酸保护起来, 稳定性好, 不会被氧化。产品无味无臭。

适合制成咀嚼片。

3.4 具有保健抗癌功能

Turley 等首次报道了维生素 E 琥珀酸酯对培养的人类肿瘤细胞生长有抑制作用。随后更多的研究表明维生素 E 琥珀酸酯对人类所有类型的肿瘤中超过 90% 的恶性肿瘤有效。维生素 E 琥珀酸酯的半数有效浓度是 5~10 mg/L 在此浓度下, 可显著抑制人类乳房、子宫颈、子宫内膜、前列腺、结肠、肺和淋巴等组织肿瘤的生长, 对正常细胞的生长无影响。

这种效果对整个完整的维生素 E 琥珀酸酯分子是有效的, 若单独使用 α -生育酚或琥珀酸或两者的混合物都没有这样的效果。维生素 E 其它的酯化形式: 如天然 d - α -生育酚醋酸酯、天然 d - α -生育酚烟酸酯都没有类似的抗癌效果。

发表在 2002 年 5 月份《国家科学学会会刊》(Proceedings of the National Academy of Sciences) 上的一项研究指出了维生素 E 琥珀酸酯能够降低前列腺癌危险性的原因。首先, 维生素 E 琥珀酸酯可以阻断前列腺特定抗原(prostate-specific antigen, PSA)的表达, 而 PSA 是前列腺癌发展的标志; 其次, 维生素 E 琥珀酸酯可以抑制雄激素受体(androgen receptors)的功能, 通过抑制雄激素受体的功能, 维生素 E 琥珀酸酯可以降低导致前列腺癌的男性荷尔蒙和遗传因子的活性。

4 国内外应用现状和前景

4.1 维生素 E 在保健食品中的应用

在欧美和日本等发达国家, 维生素 E 琥珀酸酯和维生素 E 琥珀酸钙在健康食品中的应用非常普遍, 几乎所有片剂和硬质胶囊形式的营养补充剂中使用的维生素 E 均为维生素 E 琥珀酸酯和琥珀酸钙。

Key-E-chewable (Key-E-咀嚼片) 每片含 d - α -生育酚琥珀酸酯 400 IU。

Hivita Echinacea Complex 2000(片剂)每片含: d - α -生育酚琥珀酸酯: 41.3 mg, 氨基酸锌螯合物: 25 mg, β -胡萝卜素: 1 mg。

VITA-E-PLUS 400(片剂)每片含: d - α -生育酚琥珀酸酯 400IU。

Polyantoxtm(片剂)每片含: dl - α -生育酚琥珀酸酯: 90 IU, β -胡萝卜素: 9 mg, 硒: 140 mg。

Twinlab E-200 capsules(硬胶囊)

每片含: *d*- α -生育酚琥珀酸酯: 200 IU

Vitamin E, *d*-Alpha Tocopheryl Succinate (硬胶囊)

每片含: *d*- α -生育酚琥珀酸酯: 300 IU, 混合生育酚: 45 mg。

Child Vitatim(片剂)

用途: 儿童多维、矿物质和酶咀嚼片

每片成份:

视黄醇棕榈酸酯 1.1 mg(相当于 2000 IU 维生素 A)

维生素 B₁: 1.05 mg

维生素 B₂: 1.2 mg

维生素 B₃: 12 mg

维生素 B₅: 7.5 mg

维生素 B₆: 1.05 mg

维生素 B₁₂: 2.1 mg

维生素 C: 60 mg

维生素 D: 100 IU

天然 *d*- α -生育酚琥珀酸酯: 12.4 mg(相当于 15

IU 维生素 E)

磷酸氢钙: 43 mg(相当于 10 mg 钙)

镁: 9 mg

富尔马铁: 6.1 mg(相当于铁 2 mg)

Clinical NutrientsTM for Women(片剂)

每 3 片含:

维生素 A: 17,500IU

维生素 C: 300mg

维生素 D: 100IU

维生素 E (*d*- α -生育酚琥珀酸酯): 200 IU

维生素 K: 60 mg

维生素 B₁: 60 mg

维生素 B₂: 60 mg

维生素 B₆: 95 mg

叶酸: 800 mg

维生素 B₁₂: 800 mg

生物素: 600 mg

4.2 在日本用维生素 E 琥珀酸钙制成片剂的品牌和生产厂家

E. Rohaku 片剂 100 mg: 明治药品

E-tap.S 片剂 100 mg: 医圣公司

Tecocal 片剂 100 mg: 大兴

Toovela-S 片剂 100 mg: 大洋药品

NichivitaE.S 片剂 100 mg: 日本医工

Vitamin 片剂 50 mg: 东洋药品公司

V.E. 片剂 100 mg: 东亚药品一纯药

トコハクス 100 mg: 中野药品

Juela S 100 mg: 日本卫材

4.3 国内现状与前景

维生素 E 琥珀酸酯和琥珀酸钙在欧美日等发达国家已应用数十年, 安全性非常高, 而在国内的应用则是空白。由浙江医药新昌制药厂生产的维生素 E 琥珀酸酯和琥珀酸钙, 质量等同于国外同类产品, 目前全部用于出口美国和日本等国家。新昌制药厂正致力于国内市场的开发, 多品种的维生素 E 可满足不同食品的加工需要。

·校园信息·

我校部署“十五”“211 工程”建设项目的细化论证工作

3月中旬, 中国药科大学召开了有关部门和“211 工程”各子项目组负责人会议, 校长吴晓明主持了会议, 副校长潘裕坚出席了会议。学校就“十五”“211 工程”建设项目的细化论证工作和拟购仪器设备的细化论证工作进行了部署。目前, 各子项目组正根据教育部“211 工程”办公室要求, 进行细化论证工作。各子项目组瞄准国际前沿领域, 进一步凝炼学科方向, 科学定位建设目标, 制定建设措施, 论证拟购仪器设备, 做到建设任务落实, 人员落实, 经费落实, 规范管理。通过建设, 形成一批具有优势的研究领域, 形成一批创新团队, 形成一批有显示度的标志性成果, 形成一批高水平的科研基地。