

## PEGylated Niosomes as Delivery Systems Efficiently Prolonged the Clearance Time of 2-Hydroxy-1,7-Dimethoxyxanthone *In Vivo*

Jian ZUO <sup>1,2</sup>, Wen ZHANG <sup>2</sup>, Yan XIA <sup>1</sup>, Xiang LI <sup>1</sup>\*, Jia-jie LUAN <sup>2</sup>\*, Jian-wei CHEN <sup>1</sup>

<sup>1</sup> College of Pharmacy, Nanjing University of Chinese Medicine,  
138 Xianlin Rd., Nanjing 210046, P.R. China

<sup>2</sup> Department of Pharmacy, Yijishan Affiliated Hospital of Wannan Medical College,  
92 Chizhushan Rd., Wuhu 241000, P.R. China

---

**SUMMARY.** 2-Hydroxy-1,7-dimethoxyxanthone (XAN) is an efficient antirheumatic agent isolated from *Securidaca inappendiculata* Hassk. To overcome its instinct pharmacokinetic shortcomings, PEGylated niosomes were developed as delivery systems for it in this study. The formula was optimized by series trials. Obtained niosomes was characterized by encapsulation efficiency, particle size, morphology, polydispersity index and zeta potential. Overall parameters exhibited XAN loaded PEGylated niosomes (P-XAN-NIOS) were well prepared based on the optimized formula composed of XAN, Span60, cholesterol and PEG40-SA at the ratio of 1:8:6:3. To investigate the pharmacokinetics *in vivo*, concentrations of XAN in plasma of rats were monitored continuously up to 24 h by HPLC-UV after a single intraperitoneal injection. The pharmacokinetic parameters of P-XAN-NIOS suggested a prolonged clearance time and controlled release *in vivo*. Based on these findings, PEGylated niosomes were believed to be suitable delivery systems for XAN.

**RESUMEN.** 2-hidroxi-1,7-dimetoxixantona (XAN) es un eficiente agente antirreumático aislado de *Securidaca inappendiculata* Hassk. Para superar sus deficiencias farmacocinéticas, fueron desarrollados niosomas PEGilados como sistemas de administración. La fórmula se optimizó por ensayos seriados. Los niosomas obtenidos se caracterizaron por la eficiencia de encapsulación, tamaño de partícula, morfología, índice de polidispersidad y potencial zeta. Los parámetros generales expuestos por niosomas PEGiladas cargados con XAN (P-XAN-NIOS) mejor preparados estaban basados en la fórmula optimizado compuesto por XAN, Span60, colesterol y PEG40-SA en la proporción de 1:8:6:3. Para investigar la farmacocinética *in vivo*, las concentraciones de XAN en el plasma de las ratas se monitorizaron continuamente hasta 24 h por HPLC-UV después de una sola inyección intraperitoneal. Los parámetros farmacocinéticos de P-XAN-NIOS sugirieron un tiempo de eliminación prolongada y liberación controlada *in vivo*. Basándose en estos hallazgos, se cree que los niosomas PEGilados pueden ser un sistema de suministro adecuado para XAN.

---

**KEY WORDS:** clearance time, delivery system, HPLC, 2-hydroxy-1,7-dimethoxyxanthone, PEGylated niosomes, pharmacokinetics, *Securidaca inappendiculata*

\* Authors to whom correspondence should be addressed. E-mail: lixiang\_8182@163.com (Xiang Li), luanjiajie757@163.com (Jia-jie Luan)