

# 第二篇 药物制剂的基本理论

## 第十章 表面活性剂

### 第一节 概述

#### ★一、表面活性剂的概念

界面：物质相与相之间的交界面。

表面：固体-气体、液体-气体的界面称为表面。

表面活性：使液体表面张力降低的性质。

表面活性剂：具很强表面活性能使液体表面张力明显降低的物质。

## 二、表面活性剂的概念

表面张力：使表面分子具向内运动的趋势，并使表面自动收缩至最小面积的力。原因是表面层分子受力不均所致。

$$\sigma = f_b / 2L \quad \sigma : \text{表面张力} \quad f_b : \text{外加拉力}$$

L:活动边长度

### 一、表面活性剂的概念

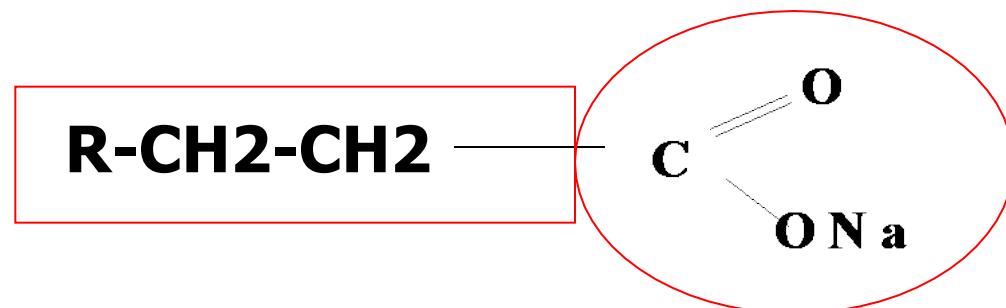
表面自由能：将内部分子拉到表面，必须克服内部分子间引力，这个过程外界所消耗的功则转化为表面层分子的位能，这种能量称为表面能或表面自由能。

当皂膜表面增大 $\Delta S$ 距离时，外力f所做功W：

$$W=f \cdot \Delta S = \sigma \cdot 2L \cdot \Delta S = \sigma \cdot \Delta A$$

表面积越大，表面能越大，体系则越不稳定

## 二、表面活性剂构造特征（亲水、亲油基团）



表面活性剂在水中会怎样排列？

### 三、表面活性剂的吸附性

1、表面活性剂的正吸附 表面活性剂溶于水，在浓度很低时，在水表面形成单分子层定向排列，亲水基团朝向水而亲油基团朝向空气。使溶液的表面张力降到纯水下列。表面活性剂在溶液表面层汇集的现象称为正吸附，简称吸附。

吸附变化了溶液表面的性质，降低了表面张力、具有湿润、乳化、起泡等作用。

2. 表面活性剂在固体表面的吸附

## 四、液体的铺展 (补充内容)

乳

剂

液体的铺展指一滴液体能在另一种不相溶的液体表面上自动形成一层薄膜的现象。由铺展系数S决定。铺展系数又由表面张力决定。

$$S = \sigma_{\text{底}} - (\sigma_{\text{铺}} + \sigma_{\text{底} \cdot \text{铺}})$$

当 $S > 0$  时，铺展液体在底层液体上能铺展。

当 $S < 0$  时，铺展液体在底层液体上不能铺展。

## 第二篇 药物制剂的基本理论 第十章 表面活性剂

### ★ 第二节 表面活性剂的分类

根据极性基团的解离性质来分类。

#### 一、离子表面活性剂

(→)阴离子表面活性剂 (常用) 活性作用—阴离子

1. 高级脂肪酸盐 (肥皂类) : 通式  $(RCOO^-)_n M^{n+}$

$C_{12} \sim C_{18}$ , 以硬脂酸、油酸、月桂酸较常用

根据M的不同, 又分为碱金属皂(钾、钠)、碱土金属皂(钙、镁、锌、铝)、有机胺皂(三乙醇胺皂)。

## 一、离子表面活性剂 (一)阴离子表面活性剂

肥皂类的特点：

- (1)乳化能力强（分散油能力强）；
- (2)易被酸、钙镁离子破坏；
- (3)电解质可使其盐析；
- (4)有刺激性只供外用。

## 一、离子表面活性剂 (一)阴离子表面活性剂

### 2. 硫酸化物

硫酸化油和高级脂肪醇硫酸酯类

通式:  $R \cdot O \cdot SO_3^- \cdot M^+$   $C_{12} \sim C_{18}$

硫酸化蓖麻油(土耳其红油)为黄色或橘黄色粘稠液体, 微臭, 与水混合无刺激性。

高级脂肪醇硫酸酯类: 十二烷基硫酸钠(月桂醇)、十六烷基硫酸钠(鲸蜡醇)、十八烷基硫酸钠(硬脂醇)等。

## (一)阴离子表面活性剂

硫酸化物的特点：

(1)乳化能力很强；

(2)性质稳定，耐酸、钙、镁离子的破坏，

但高分子阳离子药物能使之产生沉淀；

(3)对粘膜有刺激性，作为外用。

## 一、离子表面活性剂 (一)阴离子表面活性剂3. 磺酸化物

通式:  $R \cdot SO_3^- \cdot M^+$  脂肪族磺酸化物、烷基芳基磺酸化物、烷基萘基磺酸化物。

特点: (1)渗透力强, 起泡去污力好, 粘度低, 泡沫易消失, 优良洗涤剂。

(2)水溶性及耐酸、钙、镁盐比硫酸化物差, 但酸中不易水解

(3)二辛基琥珀酸磺酸钠(阿拉索-OT)、二己基琥珀酸磺酸钠、十二烷基苯磺酸钠为目前广泛应用的洗涤剂。甘胆酸钠、牛磺胆酸钠等胆酸盐亦属此类, 常作胃肠道脂肪的乳化剂和单硬脂酸甘油酯的增溶剂。

## 一、离子表面活性剂

### (二) 阳离子表面活性剂

活性作用—阳离子

分子构造的主要部分为五价氮原子，也称季铵类化合物。

特点：(1)水溶性好，在酸碱中稳定；

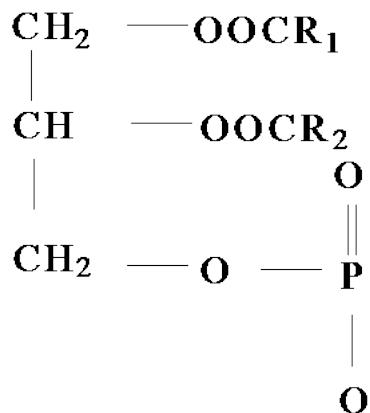
(2)表面活性强、具杀菌作用。主要用  
于杀菌、防腐。

常用具种：苯扎溴铵（新洁尔灭）、苯  
扎氯铵（洁尔灭）、氯化苯甲烃铵。

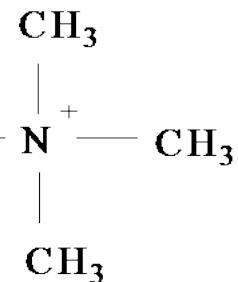
## 一、离子表面活性剂 (三) 两性离子型表面活性剂

1. 卵磷脂 天然的，主要起源于大豆和蛋黄。构成十分复杂涉及多种甘油磷脂，起源与制备不同各组分百分比不同。

基本构造：



磷酸酯盐型阴离子部分



季铵型阳离子部分

## 一、离子表面活性剂

### (三) 两性离子型表面活性剂

卵磷脂的特点：

- (1)透明、半透明黄色或黄褐色油脂状；
- (2)不溶于水，对油脂乳化能力强，无毒

常作注射剂的乳化剂；

- (3)在酸、碱、酶中易水解。

## 一、离子表面活性剂

### (三) 两性离子型表面活性剂

2. 氨基酸型和甜菜型      合成两性离子型

阴离子部分为羧酸型，

阳离子由胺盐构成称为氨基酸型，



阳离子由季铵盐构成称为甜菜型，



## 氨基酸型和甜菜型的特点：

(1)氨基酸型在等电点（微酸性）时亲水性减弱，产生沉淀。而甜菜型适合任何 pH 值，在等电点时也无沉淀。

(2)在碱性中呈阴离子的性质，起泡去污力强，在酸性中呈阳离子的性质，杀菌性强。

常用具种：TegoMHG（十二烷基双（氨乙基）-甘氨酸盐酸盐）。杀菌作用强且毒性比阳离子低。



## 二、 非离子型表面活性剂

(一) 脂肪酸甘油酯      如单硬脂酸甘油酯  亲油性强，易水解，表面活性弱，作W/O型乳化剂。 HLB值3-4。

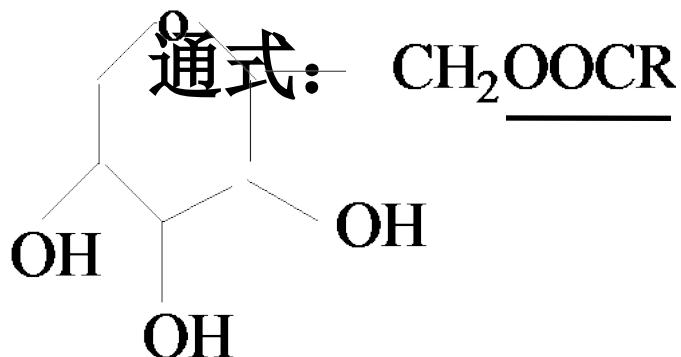
### (二) 多元醇型

1. 蔗糖脂肪酸酯      不溶于水，在水和甘油中加热形成凝胶，可溶于乙醇、丙二醇等。 作O/W型乳化剂。 HLB值5-13。

## 二、非离子型表面活性剂（二）多元醇型

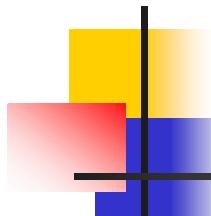
### 2. 脂肪酸山梨坦（失水山梨醇脂肪酸酯）

商品名司盘 (span)



山梨醇为六元醇脱水环合， $\text{RCOO-}$ 脂肪酸根

**特点：**亲油性强，HLB值1.8~8.6，作W/O型乳化剂和O/W型辅助乳化剂。



命名：根据脂肪酸种类和数量的不同

**司盘-20：**单月桂山梨坦

**司盘-40：**单棕榈山梨坦

**司盘-60：**单硬脂山梨坦

**司盘-65：**三硬脂山梨坦

**司盘-80：**单油酸山梨坦

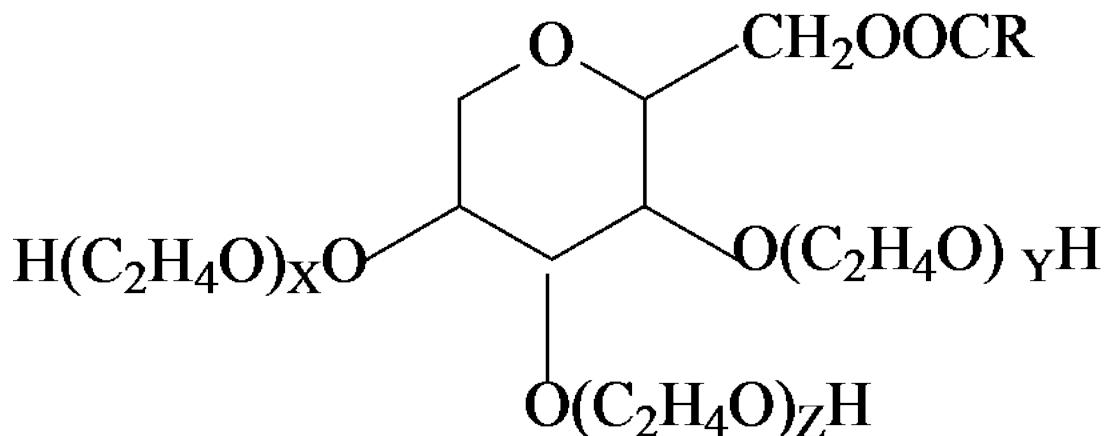
**司盘-85：**三油酸山梨坦

## 二、非离子型表面活性剂（二）多元醇型

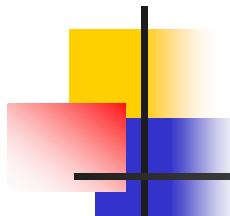
### 3.聚山梨酯（聚氧乙烯失水山梨醇脂肪酸酯）

商品名吐温(Tween)

通式：

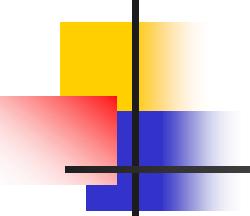


命名与司盘相相应，吐温-20（聚山梨酯-20）为单月桂酸酯。



## 聚山梨酯的特点：

- (1)聚氧乙烯基增长了亲水性，为水溶性的表面活性剂；
- (2)对热稳定，但酸、碱、酶作用下水解；
- (3)增溶作用不受溶液pH值的影响；
- (4)常作增溶剂、O/W型乳化剂、分散剂、润湿剂。



第二篇药物制剂的基本理论 第十章 表面活性剂  
第二节表面活性剂分类二、非离子型表面活性剂

### (三) 聚氧乙烯型

1. 聚氧乙烯脂肪酸酯  
由聚乙二醇与长链脂肪酸形成的酯。商品名卖泽。

通式：  $R \cdot COO \cdot CH_2 (CH_2OCH_2)_nCH_2 \cdot OH$

特点：根据聚乙二醇部分的分子量和脂肪酸品种的不同而有不同的品种。水溶性和乳化能力强，常为O/W型乳化剂和增溶剂。

## 二、非离子型表面活性剂（三）聚氧乙烯型

2. 聚氧乙烯脂肪醇醚 由聚乙二醇与脂肪醇缩合而成的醚。商品名苄泽。

通式：  $R \cdot O \cdot (CH_2OCH_2)_nH$

命名： 苄泽-30和苄泽-35分别为不同分子量的聚乙二醇与月桂醇的缩合物。

西土马哥为聚乙二醇与十六醇的缩合物。

平平加0为15个单位氧乙烯与油醇的缩合。

特点： 亲水性强作增溶剂及O/W型乳化剂。

以上内容仅为本文档的试下载部分，为可阅读页数的一半内容。如要下载或阅读全文，请访问：<https://d.book118.com/805101343021011310>