



药品



第十五章

药用高分子材料

目录



第一节 药用合成高分子材料



第二节 多糖类天然药用高分子衍生物



第三节 蛋白质类天然药用高分子及其衍生物

学习目标

- ☑ **掌握** 蛋白质的两性电离及等电点；
蛋白质变性、沉淀及颜色反应。
- ☑ **熟悉** 高分子化合物的定义及命名；
蛋白质的组成、分类和结构。
- ☑ **了解** 常见的药用合成高分子材料及多糖衍生物。



第一节

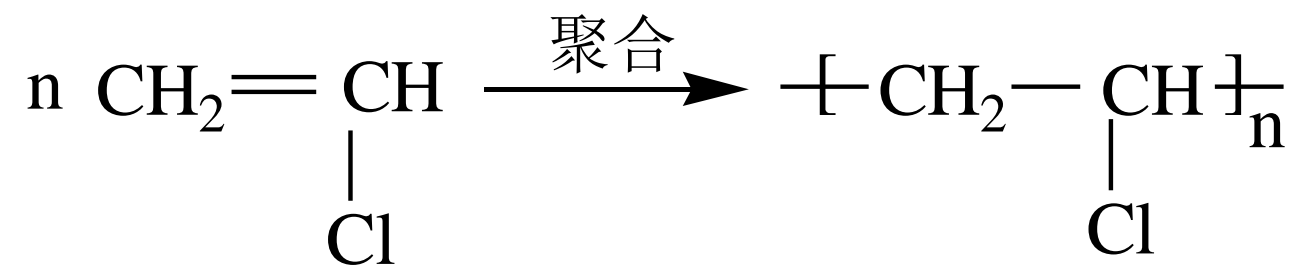
药用合成高分子材料





一、高分子化合物简介

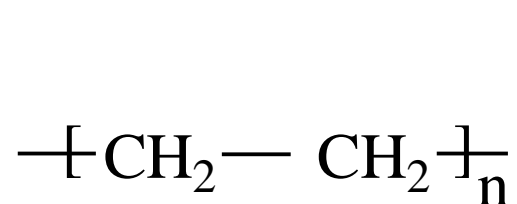
1.定义 高分子化合物是指相对分子质量很大，一般在1万以上，甚至高达几百万的大分子，如淀粉、蛋白质、聚氯乙烯等都是高分子化合物。虽然它们的相对分子质量很大，但其组成和结构一般比较简单，由若干个相同的结构单元构成，或由一种或几种称为单体的简单化合物聚合而成，因此又称为高聚物。



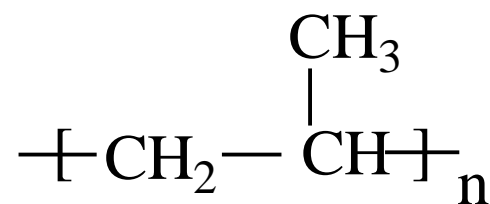


一、高分子化合物简介

2.命名 高分子化合物的命名通常采用简单命名法，根据单体的名称进行命名，由一种单体加聚而得到的高分子化合物在单体名称前冠以“聚”字。例如：



聚乙烯



聚丙烯

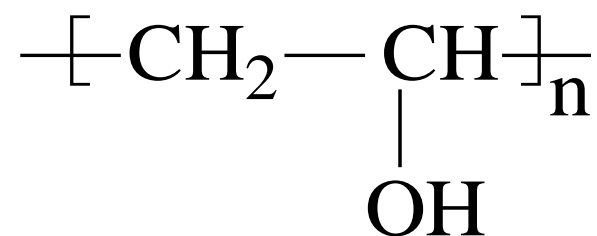
由两种或两种以上单体经过缩聚而得到的高分子化合物常在单体名称之后加“树脂”两字。例如由苯酚与甲醛的缩聚产物称为酚醛树脂。

也有根据其来源或性质用俗名的，例如淀粉、纤维素、蛋白质、塑料和橡胶等



二、药用合成高分子材料

1. 聚乙烯醇 聚乙烯醇 (PVA) 是由聚醋酸乙烯醇解而制得的, 对眼、皮肤无毒, 是一种安全的外用辅料, 可用作药液的增黏剂, 还是一种良好的水溶性成膜材料, 可用于制备缓释制剂。

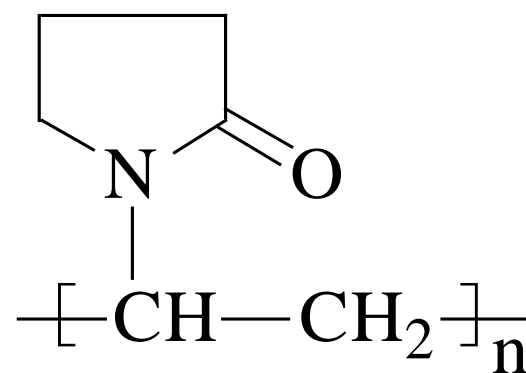


聚乙烯醇



二、药用合成高分子材料

2. 聚乙烯吡咯烷酮 聚乙烯吡咯烷酮 (PVP) 又称聚维酮, 是N-乙烯吡咯烷酮的聚合物, 溶于水, 安全无毒, 对热和酸都较稳定。

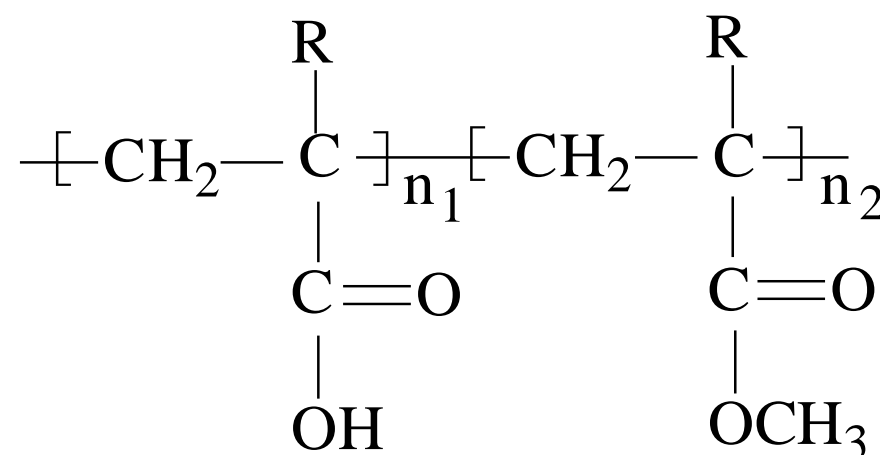


聚乙烯吡咯烷酮



二、药用合成高分子材料

3.丙烯酸树脂 通常将甲基丙烯酸、丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯等单体的共聚物统称为丙烯酸树脂，在药物制剂中常用作薄膜包衣材料。

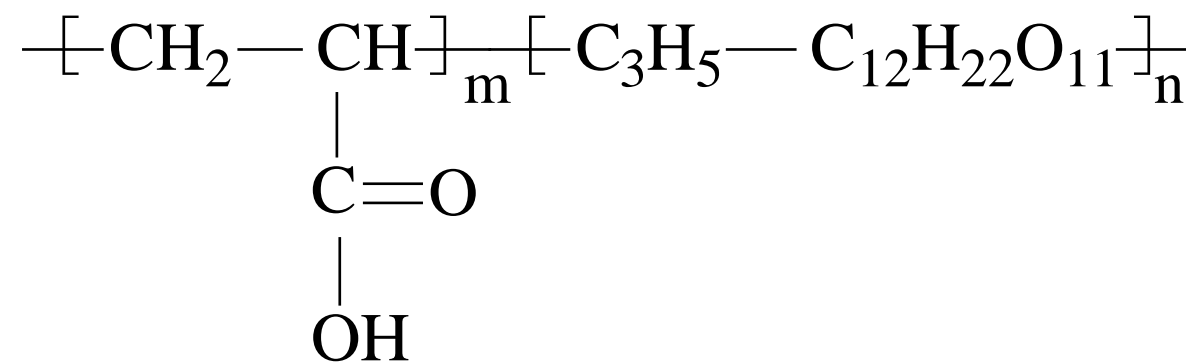


丙烯酸树脂



二、药用合成高分子材料

4.卡波沫 卡波沫由丙烯酸与烯丙基蔗糖共聚而成，是一种酸性、疏松、吸湿性强、微有特异臭的白色粉末，无毒，对皮肤无刺激性，但对眼黏膜有严重的刺激性。

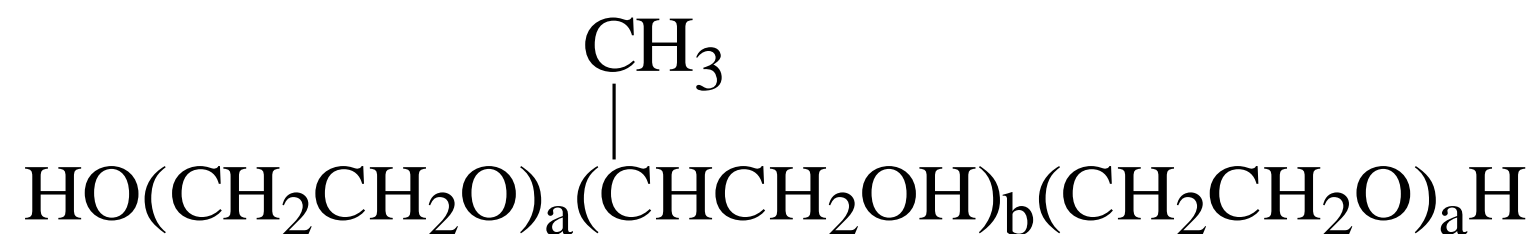


卡波沫



二、药用合成高分子材料

5. 泊洛沙姆 泊洛沙姆是聚氧乙烯-聚氧丙烯的共聚物。泊洛沙姆无味，无臭，无毒，对眼黏膜、皮肤具有很高的安全性。



泊洛沙姆



第二节

多糖类天然药用高分子衍生物





一、淀粉及其衍生物

淀粉是人类的主要食物，也是制药工业中合成葡萄糖等药物的重要原料。淀粉常用作药物制剂的赋形剂。此外，淀粉还用于制备羧甲基淀粉钠（CMS-Na）。羧甲基淀粉钠为白色粉末，无臭，具有较强的吸湿性，吸水后最多可使其体积溶胀300倍，但不溶于水，只吸水形成凝胶，不会使沉淀的黏度明显增加，可作药片及胶囊的崩解剂。



二、纤维素衍生物

1.微晶纤维素 纤维素分子由排列规则的微小结晶区域（约占分子组成的85%）和排列不规则的无定形区域（约占15%）组成。用强酸除去纤维素中的无定形区域得到白色的微晶纤维素，它的黏合力很强，可用作片剂的黏合剂、填充剂、崩解剂或润滑剂，片剂中的水溶性成分也可用微晶纤维素吸收。用脱脂棉制得的微晶纤维素是良好的赋形剂，其优点是可直接与药物混合后压片而不必制成颗粒。



二、纤维素衍生物

2.乙基纤维素 乙基纤维素是纤维素的乙基醚类，是用氯乙烷在碱性条件下与纤维素反应制得的。乙基纤维素为白色颗粒，可溶于乙醇、丙酮、乙酸乙酯和二氯乙烷等有机溶剂，它不易吸湿，浸于水中吸水量极少，且极易蒸发。乙基纤维素广泛用作缓释制剂、固体分散载体，适用于对水敏感的药物。将其溶于有机溶剂中可作黏合剂、薄膜包衣材料，亦用作骨架材料制备多种类型的骨架缓释片；用作混合膜材料制备包衣缓释制剂；用作包囊辅助材料制备缓释微胶囊。



二、纤维素衍生物

3.羟丙基纤维素 羟丙基纤维素是纤维素的羟丙基醚类，是用纤维素与环氧丙烷在碱催化下反应制得的。目前应用最广的是低取代羟丙基纤维素，它不溶于水，也不溶于有机溶剂，但可在水中溶胀，用作崩解剂。在制剂中广泛用作黏合剂或粒剂、薄膜包衣材料等。



第三节

蛋白质类天然药用高分子及其衍生物





(一) 蛋白质的组成和分类

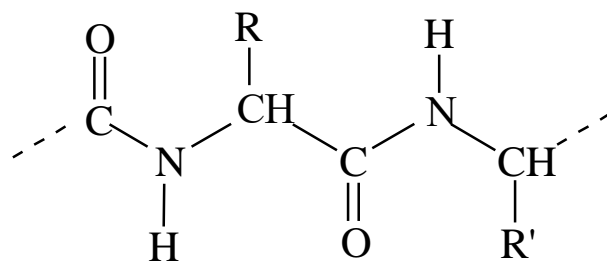
组成：蛋白质是由许多 α -氨基酸通过肽键连接而成的化合物。不同来源的蛋白质，其组成元素都很相似，主要有C 50%~55%、H 6%~7%、O 19%~24%、N 13%~19%、S 0%~4%；有些蛋白质还含有磷、铁、碘、锌及其他元素。

分类：一般按其化学组成不同分为单纯蛋白质和结合蛋白质两大类。单纯蛋白质仅由 α -氨基酸组成，如乳清蛋白、蛋清蛋白、角蛋白，此类蛋白质水解的最终产物都是 α -氨基酸；结合蛋白质由单纯蛋白质和称为辅基的非蛋白质两部分结合而成，如糖蛋白、脂蛋白、核蛋白、磷蛋白、血红蛋白等。

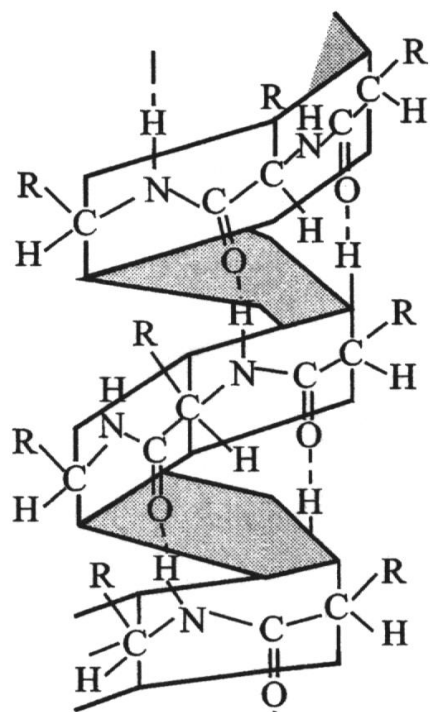


(二) 蛋白质的结构

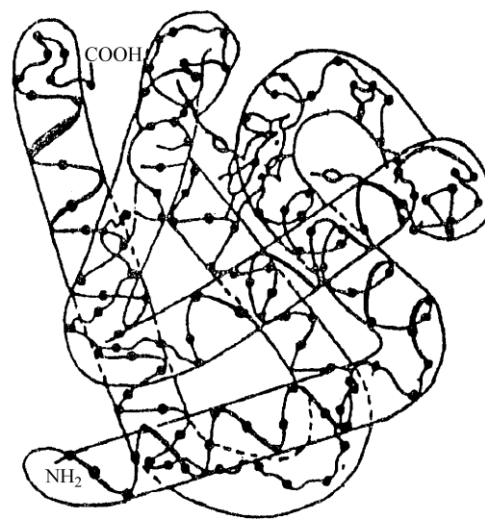
常将蛋白质的结构分为一级结构和二、三、四级结构。



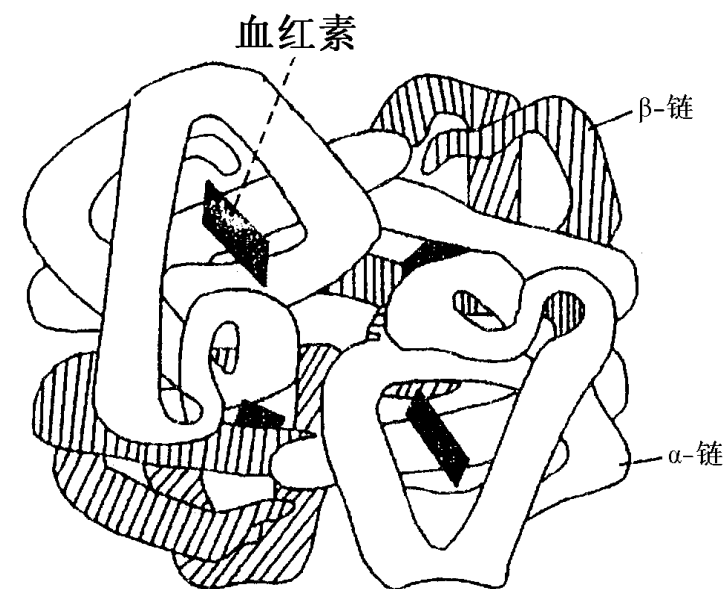
一级结构



二级结构



三级结构

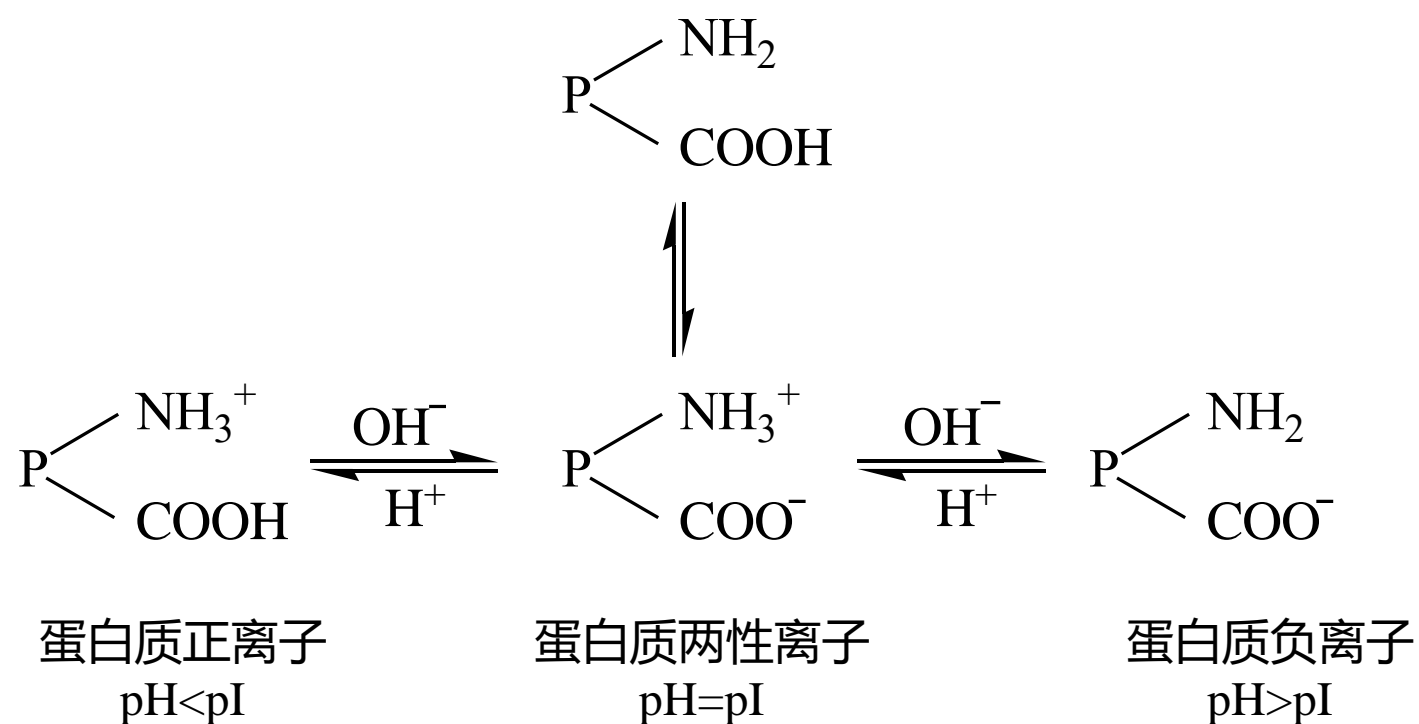


四级结构



(三) 蛋白质的性质

1.两性电离及等电点 蛋白质和氨基酸一样，产生两性电离。调节蛋白质溶液的pH至某一数值，使其酸式电离和碱式电离程度相等，则蛋白质完全以两性离子的形式存在，此时溶液的pH称为该蛋白质的等电点，用pI表示。





(三) 蛋白质的性质

1.两性电离及等电点 每种蛋白质因其所含的游离氨基和羧基数目不同，故其等电点也不相同。

一些蛋白质的等电点

蛋白质	来源	等电点	蛋白质	来源	等电点
白明胶	动物皮	4.8~4.85	血清蛋白	马血	4.88
乳球蛋白	牛乳	4.5~5.5	血清球蛋白	马血	5.4~5.5
酪蛋白	牛乳	4.6	胃蛋白酶	猪胃	2.75~3.0
卵清蛋白	鸡卵	4.84~4.90	胰蛋白酶	胰液	5.0~8.0



(三) 蛋白质的性质

2.变性 蛋白质分子受某些物理因素（如加热、紫外线、超声波、高压等）和化学因素（如酸、碱、有机溶剂、重金属盐、尿素、表面活性剂等）的影响，使蛋白质分子的空间结构发生改变，从而导致生物活性的丧失和理化性质的异常变化，这种现象称为蛋白质的变性。

变性分为可逆和不可逆两种。如尿素、氯化钠等引起蛋白质的变性，除去变性因素后，蛋白质仍能恢复原有的性质，这种变性称为可逆变性；相反，如高温， Hg^{2+} 、 Pb^{2+} 、 Cu^{2+} 等重金属离子使蛋白质的变性称为不可逆变性。



(三) 蛋白质的性质

3.沉淀 蛋白质是高分子化合物，分子颗粒的直径范围为 $0.001\sim 0.1\mu\text{m}$ ，因此其水溶液具有胶体溶液的性质。

在通常情况下，蛋白质分子颗粒表面含有氨基、羧基、巯基和肽键等许多亲水基团，能与水分子起水合作用，形成**水化膜**，防止蛋白质的沉淀析出。另外，蛋白质溶液都带有**相同的电荷**，由于同性电荷的相互排斥，使蛋白质不易凝聚。

即由于**水化膜的存在**和**带有同种电荷**这两个方面的主要因素，可形成稳定的蛋白质溶液。



(三) 蛋白质的性质

3.沉淀 要使蛋白质凝聚沉淀，必须除去蛋白质溶液稳定的两个因素。调节蛋白质溶液的pH至等电点，使蛋白质分子呈电中性，再加入适当的脱水剂除去水化膜，则蛋白质分子凝聚而从溶液中沉淀析出。

沉淀蛋白质的方法有**盐析** (NaCl 、 Na_2SO_4)，加入**脱水剂** (乙醇、丙酮)、**重金属盐** (Hg^{2+} 、 Pb^{2+} 、 Cu^{2+}) 和**生物碱沉淀试剂** (鞣酸、苦味酸) 等。



(三) 蛋白质的性质

4.颜色反应

(1) **缩二脲反应**：蛋白质分子结构中含多个肽键，故能发生缩二脲反应，即蛋白质在碱液中与硫酸铜溶液作用呈红紫色。

(2) **茚三酮反应**：蛋白质分子中仍存在 α -氨基酸残基，故能与水合茚三酮溶液共热产生蓝紫色。

(3) **黄蛋白反应**：蛋白质分子中含有苯丙氨酸、色氨酸或酪氨酸等含苯环的氨基酸残基，在其溶液中加入浓硝酸，则产生沉淀，再加热沉淀变为黄色。

(4) **米伦反应**：蛋白质分子中含有酪氨酸残基时，在其溶液中加入米伦（Millon）试剂（硝酸汞和硝酸亚汞的硝酸溶液）即产生白色沉淀，再加热则变暗红色。

小结

1. 高分子化合物在药物制剂中经常是作为辅料使用，包括药用合成及天然药用高分子材料。
药用高分子材料要求无毒、安全，有良好的生物相容性和稳定性，用于改进药物的剂型。
2. 羧甲基淀粉钠、乙基纤维素等多糖类天然药用高分子材料以其功能特殊、性能优良，常用于药物制剂的辅料。淀粉、纤维素等多糖类天然药用高分子材料用作黏合剂、崩解剂、赋形剂及缓释材料。
3. 蛋白质是天然的生物高分子，如胶原蛋白、明胶、白蛋白等，也是一类无毒、安全、生物相容性良好的蛋白质类药用高分子材料或药物。蛋白质受高温、高压、紫外线或乙醇、丙酮、重金属盐等理化因素作用，可使蛋白质析出沉淀，发生变性。



第十五章 药用高分子材料

THANKS

谢谢观看