

# 硅酮凝胶的制备及稳定性

黄明亚(上海 200025 上海第二医科大学附属瑞金医院药剂科)

**摘要** 应用卡波姆(carbomer, carbopol, 卡波普、聚羧乙烯)制备外用的硅酮凝胶剂,并考察其稳定性,测定油性成分的含量,此制剂保存在密闭容器中性质稳定。本凝胶质地细腻,易涂展,用于灼伤硬痂软化,防止开裂,有较好的效果。

**关键词** 卡波姆;凝胶;二甲硅油;月桂氮革酮

## Preparation and stability of dimethicone gel

Huang Mingya(Huang MY), (Department of Pharmacy, Shanghai Ruijin Hospital, Shanghai 200025)

**ABSTRACT** A new vehicle, carbomer(CBP-Ⅱ) was used to prepare dimethicone gel for external application. Stability of this gel and content of dimethicone and lauracpram were determined. This gel is fine in appearance and easy to spread. A satisfactory therapeutic effectiveness was achieved on intensifying burnable scab in clinical observation.

**KEY WORDS** carbomer(carbipol), gel, dimethicone, lauracpram(azone)

二甲硅油为有机硅氧化物的聚合物,对皮肤无毒性,刺激性小,有较强的疏水性,润滑而易涂于皮肤,对皮肤有润滑和保护作用。月桂氮革酮为非极性透皮促进剂,可使角质软化,增强通透性,提高制剂的生物利用度,以获得较为理想的治疗目的<sup>[1]</sup>。卡波姆树脂是已交联的丙烯酸聚合物,用卡波姆制备的凝胶剂稳定性良好,质地细腻美观,涂擦舒适滑爽,而且卡波姆与皮肤耦合效果极佳<sup>[2]</sup>。我院灼伤科用此硅酮凝胶涂于创伤后结成的硬痂上,有较好的软化作用,能有效预防硬痂开裂。本品涂于皮肤表面形成油膜,起保护、防晒、治疗的目的,而不影响皮肤的呼吸,能保护皮肤,防止皮肤皲裂及酸性物质引起的皮炎等<sup>[3]</sup>。本文就硅酮凝胶的制备及不同条件对其稳定性的影响做了一系列实验,现报道如下。

### 1 仪器和试剂

电动搅拌机(上海红旗医疗器械厂,转速:500~

1000~1500r/min);离心沉淀机(上海医疗器械厂,800型,转速:0~4000r/min);恒温干燥箱(上海跃进医疗器械厂,型号202-2-S);卡波姆(解放军防化研究所,CBP-Ⅱ型,批号:4-217);二甲硅油(杭州朝晖有机硅厂,规格:500mm<sup>2</sup>/s,批号:920218);月桂氮革酮(上海朝江化工厂,批号:9401190)。

### 2 硅酮凝胶的制备

**2.1 处方:**二甲硅油 20g;月桂氮革酮 5g;三乙醇胺 1g;卡波姆 1.5g;蒸馏水加至 100g。

**2.2 制备方法:**先将卡波姆溶于水,搅拌均匀后缓缓加入三乙醇胺不断搅拌成透明凝胶,调节 pH 至 6.5~7.5 之间,加入二甲硅油充分搅匀,待冷后加入月桂氮革酮搅匀,最后加适量水至全量,搅拌均匀分装于密闭容器中。

### 3 质量控制

#### 3.1 性状

本品为无臭、乳白色胶冻状半固体物质。

### 3.2 鉴别

取本品 0.5g,置坩埚中加硫酸 0.5ml 和硝酸 0.5ml,缓缓炽灼,即形成白色纤维状物,最后遗留白色残渣<sup>[4]</sup>。

### 3.3 pH

取本品约 0.5g,加蒸馏水 20ml 稀释均匀后测 pH,结果 pH 应在 6.5~7.5 之间。

### 3.4 含量测定

取本品约 1.0g 精密称定,加蒸馏水 30ml 溶解均匀,加入冰醋酸试液调节 pH 至 3 左右(约 5ml),用氯仿提取 8 次,每次 15ml,用分液漏斗分离氯仿液,合并氯仿液至 110℃干燥至恒重的蒸发皿中,在水浴上蒸干,并在 110℃干燥至恒重,精密称定,即得供试品中含二甲硅油和月桂氮䓇酮的重量。含量为 22.5%~27.5%。

### 3.5 稳定性试验

**3.5.1 温度:**将此凝胶装在密闭容器分别放置于-10℃、4℃、20℃、60℃下观察其稳定性,结果见表 1。

表 1

| 温度    | -15℃ | 4℃  | 20℃ | 60℃ |
|-------|------|-----|-----|-----|
| 放置时间  | 24h  | 72h | 72h | 6h  |
| 内容物渗出 | +    | -   | -   | -   |
| 水份蒸发  | -    | +   | +   | ++  |

此凝胶基质 0℃以上性质稳定,无油性物质渗出,在密闭盒盖内有水蒸汽。而在-15℃时由于水份冻结,对卡波姆的树脂结构有一定影响,因而对油性内容物包容性降低,出现少量油性物质渗出。

**3.5.2 氧化:**空气:此凝胶开口置于室温下,有明显失水,且凝胶基质氧化后缩合,油性内容物渗出。不同比例卡波姆制得凝胶在室温下开口放置 6 个月,结果如表 2。

表 2

| 卡波姆比例   | 1%  | 1.5% | 2%  |
|---------|-----|------|-----|
| 失水比例    | 36% | 29%  | 23% |
| 油性物渗出比例 | 78% | 60%  | 78% |

卡波姆含量高,失水量少,而在 1.5%时油性内容物渗出量较少,故在处方中选用 1.5%的浓度。

**光照:**将硅酮凝胶开口置于紫外灯下照射 8h,基质失水但无明显油性物质渗出。而先将硅酮凝胶开口在室温下避光放置 15 天,凝胶开始缩合且表面有少量油性物质渗出时,再放在紫外灯下照射 8h,凝胶基质完全

缩合,油性内容物渗出。由此可见空气可使卡波姆基质氧化缩合,而光线仅在此基质氧化开始后加速其氧化进程。

**3.5.3 乳化剂:**凝胶中加入乳化剂后先在-15℃冷冻 24h,取出置于室温下充分解冻,然后于 3500r/min 离心 20min,结果如表 3。

表 3

| 分层情况         | 冷冻前离心 | 冷冻后离心         |
|--------------|-------|---------------|
| 硅酮凝胶         | -     | ++ (2.0mm 油层) |
| 硅酮凝胶+5%甘油    | -     | +(0.5mm 油层)   |
| 硅酮凝胶+2%吐温-20 | -     | +(0.5mm 油层)   |
| 硅酮凝胶+5%吐温-20 | -     | +(0.5mm 油层)   |
| 硅酮凝胶+2%吐温-80 | -     | +(0.5mm 油层)   |
| 硅酮凝胶+5%吐温-80 | -     | +(0.5mm 油层)   |

卡波姆基质冷冻冻结后对油性内容物包容能力降低,吐温类乳化剂和甘油均可使冷冻后的凝胶油性内容物渗出减少,故在寒冷季节可考虑加入适量甘油。

**3.5.4 霉变:**不同处方凝胶在室温下开口置于空气中霉变情况见表 4。

表 4

| 处方 1 | 1.5%卡波姆         | 霉变 | ++ |
|------|-----------------|----|----|
| 处方 2 | 1.5%卡波姆+20%二甲硅油 | 霉变 | +  |
| 处方 3 | 处方 2+5%月桂氮䓇酮    | 霉变 | -  |
| 处方 4 | 处方 3+5%甘油       | 霉变 | -  |
| 处方 5 | 处方 3+2%吐温-20    | 霉变 | +  |
| 处方 6 | 处方 3+2%吐温-80    | 霉变 | +  |

注:++为表面长满霉菌;+为表面有菌斑;-为无霉菌生长

卡波姆基质容易霉变,加入油性物质霉变减轻,加入月桂氮䓇酮后可抑制霉菌生长,而吐温类乳化剂可降低月桂氮䓇酮的抑菌作用。

## 4 讨论

**4.1** 卡波姆为高分子丙烯酸交联聚合物,为白色、疏松的粉末,引湿性强,水溶液具良好的粘度,稳定性强,安全无毒,不会诱导致敏和产生刺激性,卡波姆原料在存放时要密闭防潮,其吸潮后结成硬块,需浸泡数日方可溶解完全,加热能加快卡波姆溶解。配制时须待卡波姆完全溶解均匀后再加入三乙醇胺调节 pH,否则团块不能溶解。

**4.2** 卡波姆基质在搅拌中温度会升高,而温度过高其对油性物质的包容性减低,故宜在 40℃以下加入二甲硅油。

**4.3** 月桂氮䓇酮对卡波姆的粘性有一定影响,特别在温度偏高时可使卡波姆树脂链缩合,弹性增强不易涂

展,而在常温下影响较小,仅使卡波姆基质粘度稍有增大,但仍易于涂展,故月桂氮䓬酮需待凝胶基质冷至室温下加入为宜。

4.4 卡波姆凝胶基质对氟仿亦有一定的包容性,加入酸溶液使其 pH 降低至 3 左右时可破坏其凝聚性能,再加入氟仿后即能较快分层。

#### 参考文献

1 罗明生,高天蕙主编.药剂辅料大全.四川科学出版社,

1993:285.

2 袁继民,等.现代药物制剂技术.第一版.济南:济南出版社,1992:327.

3 雍德卿主编.实用医院制剂注解.人民卫生出版社,1997:250.

4 中国药典.二部.1995:8.