

# 医药级卡波姆 在医药生产中的应用指南

北京国人逸康科技有限公司

## 卡波姆应用指南

中文名：卡波姆

化学名：交联聚丙烯酸树脂

分子结构：-[-CH<sub>2</sub>-CH-]N-COOH

外 观：松散白色,微酸性粉末.

堆积密度：约 208 千克/米<sup>3</sup>(13 磅/立方尺)

比 重：1.41g/cm<sup>3</sup>

运送时含水量：最大 2.0%

平衡水份量：8-10% (相对湿度 50%时)

**PH** 值：2.5-3.0 (1%水分散体)

**PH** 值：2.7-3.5 (0.5%水分散体)

当 量：76±4

灰粉含量：0.009ppm (平均值)

玻璃化温度：100-105℃(212-221F)

卡波姆在很低的用量下(常规用量 0.25-0.5%)就能产生高效的增稠作用，从而，制备出粘度范围很宽和流变性不同的乳液、膏霜、凝胶和透皮制剂。

### 药用卡波姆的性质：

卡波姆是聚烷基蔗糖或聚烷基季戊四醇与丙烯酸交联轴聚合物的共聚物，根据聚合时使用的材料和聚合度的不同形成多种药用规格的产品。常用的有

940GE、941GE (P)、934GE、934(P) 和 980.1342(P)；其中，GE代表药用级，P代表口服级，所以，940GE可用于外用制剂，934(P)、1342(P)和 980(P)则只可用于口服制剂；卡波姆为白色疏松粉末，具有较强的吸湿性，由于其分子结构中含 52~68%的酸基团，因此，具有一定的酸性；1%水分散体的PH为 2.5~3.0.，可用碱性物质中和，形成凝胶。当卡波姆被中和使羧基离子化后，会由于负电荷的相互排斥作用，使分子链弥散伸展，呈极大的膨胀状态而具有粘性。

### 主要功能：增稠、悬浮、乳化

#### 一、增稠

卡波姆是含有聚烯基聚醚交联的丙烯酸聚合物；这些树脂呈弱酸性，弱于醋酸，很容易生成盐类；随树脂浓度的不同其在水中的PH值在 2.8—3.2 的范围之间变动；浓度越高，羧基浓度也越高，其PH值便更低。

#### A. 水物系的中和

一个丙烯酸的分子在干粉状态下其碳链是紧密聚集的；当被分散到水中以后，分子渐渐地被水和，从而使紧密聚集的碳链开始疏松，相应的分散体系粘度增大；如要达到最高的粘度，聚集碳链必须完全地舒展开。添加中和剂是使碳链完全舒展开的常规办法，常用的中和剂：氢氧化钠、氢氧化钾或有机胺类（如：三乙醇胺、胺基甲基丙醇）。中和剂使卡波姆沿主链生产负电荷；在碳链骨架上形成负电荷，排斥力使其形成伸展的结构。一但卡波姆被中和至 PH 值 5—9 之间，分子体积则膨胀 1000 倍，直径增加 10 倍。

#### **B. 含水物系 — 氢键结合**

卡波姆的水和分子也可以加 10—20%的羟基给予体，若具有 5 个或以上乙氧基的非离子型表面活性剂，则使其卷曲分子在含水系统中伸展开；由于氢键结合不是瞬息完成的反应，需要 5 分钟到三个小时稠度才能达到最高值；将分散体加热到 70°C（158° F）的温度不宜采用。

### C. 含溶剂物系 — 氢键结合

二醇类，三醇类及多元醇类的多羟基及多乙氧基溶剂不必中和即能被卡波姆增稠；卡波姆树脂与这类溶剂生成强的氢键，利用上述组份作为其它溶剂的改良剂或配合混合溶剂应用范围更广。

## 二、悬浮

卡波姆能使液态系具有特别的屈服值及流变性，只需很低的浓度就能使一些不溶添加剂(如颗粒、油滴等)达到永久性悬浮。正是由于这一很强的悬浮能力，使卡波姆被广泛的应用。用来稳定传统的乳液和膏霜；悬浮溶液中的油颗粒及水不溶物。其它的增稠剂往往不能提供很高的增稠悬浮力与屈服值。

## 三、乳化

卡波姆在油/水相中起着主要的乳化和稳定作用，在水/油乳剂中作为稳定剂、它们能无限度地控制粘度。

卡波姆的流变性、大多数卡波姆凝胶几乎无流变性、当卡波姆凝胶受力后、粘度会马上降低、但当应力消失后、其粘度马上能恢复。

### 卡波姆在药剂学中的应用

卡波姆是一种聚丙烯酸交联聚合物，在很低的浓度下即能够形成高粘

度的凝胶。因此，自从它在 50 年代首次应用以来，在药学界一直获得推崇。卡波姆在国外已广泛用于化妆品和药品的研究和生产，但在国内还是一种较新的材料；它在药剂中有多种用途，如可作为增稠剂、助悬剂、凝胶基质、生物粘附材料和控缓释剂的骨架材料等。

## 北京国人逸康科技有限公司关于

### 药用亲水性产品用途

- 1 固体剂型一片剂和胶囊
  - 干片粘合剂
  - 控制释放剂—亲水性基质(骨架)系统
- 2 液体口服剂型
  - 流变学改进剂
    - 使多种水溶液和酒精溶液增稠
    - 使不良味道遮盖
    - 使不溶性成分混悬
    - 多项乳剂
    - 使乳剂稳定
- 3 液体局部使用剂型
  - 流变学改进剂
    - 透皮药物贮库
    - 凝胶
    - 洗剂
    - 凝胶剂
    - 软膏
    - 聚合乳化作用
  - 诊断性凝胶剂
    - 1). 心电图 2). 超声波
- 4 液体眼用制剂
  - 流变学改进剂
    - 增湿剂
    - 润滑剂
- 5 半固体制剂
  - 栓剂
  - 曾湿剂
  - 润滑剂
- 6 新的给药系统
  - 生物粘合剂
    - 口含生物粘合剂
    - 渗透泵
    - 鼻用生物粘合剂
    - 直肠生物粘合剂

- 阴道生物粘合剂
- 电离子透入疗法
- 7 增溶性轻泻剂
- 8 抗腹泻剂
- 9 酯 / 酰胺合成原料
- 内用生物粘合剂
- 眼用生物粘合剂

## 北京国人逸康科技有限公司关于

### 卡波姆 (carbomer) 应用表

卡波姆 (均匀聚合物)	粘度(厘泊数)	建议用途
934GE	20000-40000	局部给药系统, 在高粘度时稳定, 用于浓凝胶剂、乳剂、混悬剂 <a href="http://www.bjgryk.com">http://www.bjgryk.com</a>
934P	20000-40000	口服、局部和新的给药系统; 控释骨架片
940P	40000-60000	口服、局部和新的给药系统; 控释骨架片
940GE	40000-60000	局部给药系统, 结晶澄明的凝胶剂、水或酒精
941GE	3000-11000	局部给药系统, 高乳剂稳定作用, 具有良好澄明度的稀凝胶剂
974P	30000-40000	口服、局部和新的给药系统, 控释骨架片
971P	2000-11000	口服、局部和新的给药系统, 控释骨架片、助悬剂
980GE	40000-80000	局部给药系统, 结晶澄明凝胶剂、水或酒精溶剂
卡波姆 (共聚物)	粘度 (厘泊数) 0.5%中性溶液	建议用途
1342GE	10000-30000	局部给药系统, 在电介质存在下, 极好的流变学改进剂; 聚合乳化作用
1382P	10000-30000	口服、局部给药系统, 在电介质存在下, 极好的流变学改进剂; 聚合乳化作用

卡波姆为白色疏松状; 具酸性、吸湿性和微有特殊臭味; 能溶于水、乙醇、甘油, 常用浓度为 0.1%~3.0%。由于其分子中含大量羧基, 故水溶液应特别注意应在用碱中和后使用, 以减少对皮肤、粘膜的刺激。卡波姆的中和剂可用氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸氢钾、硼砂、氨基酸类和极性有机胺类 (如: 三乙醇胺); 月桂胺和硬脂胺可在非极性系统中作中和剂。中

和后的卡波姆水凝胶在 pH6~11 之间最粘稠，如 pH<3 或 pH>12 粘稠度即降低；强电解质存在亦可降低粘度 [4]。凝胶不稳定，暴露于阳光下易生长霉菌并迅速失去粘度，加入抗氧化剂可减缓反应。

### 制备方法与应用

卡波姆被广泛的应用于药品和化妆品中，在药剂中的应用见表 2。现用卡波姆 934 制作一种凝胶型软膏基质，处方及制备方法如下：

卡波姆的应用：

制剂类型	常用浓度	应用范围
液体	0.1~0.5	用作液体制剂增稠及助悬，利用本品与碱性药物成内盐能缓慢释放的性质，制备缓释液体制剂。
半固体	0.5~3.0%	利用本品的增稠及胶凝性，用作软膏、霜剂、栓剂的基质。
固体	不定	利用本品的粘性可作片剂的粘合剂；利用成膜性可作颗粒剂和片剂的包衣材料；利用本品与碱性药物反应生产衍生物；用于制备固体长效制剂。

卡波姆 934 1g、水 45.4g、甘油 53.4g、三乙醇胺 1.1g，先将树脂溶于水，待完全溶胀后加入甘油混匀或过胶体磨，均匀后加入三乙醇胺，可得到透明的凝胶。加三乙醇胺时，尽量减少气泡生成；此基质具水溶性基质的特点，外观透明美观，搽于皮肤上有特别的细腻滑爽感，与皮肤藕合效果极佳。以卡波姆为基质的软膏应贮存于密闭避光的容器内。

实验曾用卡波姆 934P 制作一种口腔制剂基质 [5]，将其经口服做急性毒性、过敏和粘膜刺激等实验，结果 LD50 值与文献报道一致，说明卡波姆 934P 作为口服制剂的基质安全。

### 卡波姆在片剂中的应用

使用卡波姆作为辅料的片剂表现出零级的释放动力学。卡波姆在低含量（小于 10%）时即能模拟胃液或肠液快速有效地形成凝胶。在压片力范围较宽的条件，可以制得牢固度好且易碎度低的产品。与其他的控释赋形剂不同的是：卡波姆在低用量下，药物同样能达到长时间的释放要求，配方中用量弹性很大，卡波姆为优秀的功能性控释赋形剂。

### 卡波姆在药物制剂中应用的优势

- 药物线性释放（零级释放动力学）
- 能增加生物利用度
- 低用量支持缓慢释放
- 节省成本
- 增加配方的选择性
- 能减少片剂的体积
- 合成聚合物的重现性好
- 制备好的片剂需要的压片力低
- 能和纤维素以及其它的组分很好地配伍。

### 卡波姆应用于缓释制剂的优点

1. 可制成具有零级释放的药物；



2. 相对而言，用量较低，可节约费用及增加配方的选择余地；
3. 卡波姆在低压下用量仍具有很好的可压性；
4. 卡波姆与纤维素和其他大多数辅料相容性好；
5. 可增加生物利用度，并显示出较好的体内外相关性；
6. 因属合成材料，故比半合成或天然产品在性能上更具一致性。

### 使控制释放最佳

使用卡波姆聚合物作为控制释放辅料时，它会增加处方和生产的灵活性，当然所得到的好处取决于——对释放面的选择、与其它辅料的相容性和应用标准生产方法的能力。934P 和 980P 可以较低浓度组成处方，并在低压片力下生产出具有良好易碎度的硬片。与羟丙基甲基纤维素和羟丙基纤维素相比，卡波姆在较低浓度下提供的药物缓释时间要长得多。

### 卡波姆在口服剂混悬制剂中的应用

#### 口服混悬剂

卡波姆应用于口服混悬剂的历史已有多多年，其主要功能是增稠、改善体系流变性及悬浮组分和提供生物粘附性。聚丙烯交联树脂能提供出色的悬浮能力，并有效的悬浮不溶组份；甚至在卡波姆用量非常低的情况下也有极好的效果。卡波姆在水分子被中和后膨胀，形成一个均匀分散骨架体系，不溶组分在体系内可以永久地被包裹在骨架间隙中。

#### 卡波姆应用在口服混悬剂中的优点

卡波姆最适合于亲水性的口服混悬制剂。目前众多已商品化的混悬剂都选用卡波姆，它能提供多方面的优点：

1. 在口服制剂中安全有效；
2. 在低用量下有高屈服的特点；
3. 可对某种口感颇苦的药物成份进行遮味；
4. 具备生物粘附性，可以使口服制剂的生物利用度提高；
5. 能在较宽的 PH 值范围内保持稳定；
6. 能忍受反复的冷冻与解冻，而且能在高压下稳定。

### 卡波姆在生物粘附制剂中的应用

#### 一、眼用生物粘附剂

许多眼用药物吸收性较差，主要原因是因为流泪使药物很快消除。延长药物在角膜的滞留时间可增加药物的吸收性和延长作用时间。卡波姆可以使滴眼液在眼中有较长的滞留时间，用卡波姆可制得均匀透明的眼用凝胶，调节合适的 PH 值使其对眼无刺激。实验发现，卡波姆与眼的接触时间有浓度依赖性，浓度 2% 的凝胶，眼接触时间约为 2—2.5h。接触时间与凝胶弹性呈良好相关性。

#### 二、鼻内生物粘合剂

卡波姆的特性使它成为鼻内给药的理想辅料。它除了有生物粘附性外，还具有剪切稀化效应，因此，它可以制成很稠的凝胶，喷到鼻腔内形成薄雾，能提高药物的生物利用度。

#### 三、阴道生物粘合剂

药物在阴道内长期释药是很难解决的问题，而卡波姆解决了药物在阴道内长期释药的问题。在阴道中，重要的是使药物局部释放到其吸收部位。阴

道增湿剂、激素补充疗法、长效杀精子剂、杀真菌剂及抗生素，都是用于卡波姆的生物粘合特性的理想药物。

#### 四、直肠内生物粘合剂

药物作用于直肠，最重要的是使给药系统把血流接触最多的下段直肠作为目标，希望能达到全身给药的目的，在直肠给药中，卡波姆已使用多年，当卡波姆浓度从 0—5% 开始增加时，血药浓度及生物利用度明显提高。

#### 五、胃肠道生物粘合剂

对于在胃或上段肠道吸收的药物，胃内滞留系统最为满意。由于蠕动波会冲掉胃内多种系统及它们所包含的药物而难达目的，因而，使用生物粘附材料可使药物附着于肠道的粘蛋白内而延长胃肠道药物的输送时间。

#### 六、片剂

片剂工艺简单、体积小、使用、贮存方便且缓控释效果好，它是生物粘附剂中最常用的剂型。

#### 七、膜剂

膜剂的优点是：与粘膜接触面积大、粘合紧密。

### 卡波姆在中药制剂中的应用

为了改善中药片的外观和提高传统中药制剂的质量，近几年来，越来越多的中药片剂由原来的糖衣改为薄膜包衣。由于中药浸膏片固有的可压性差的特性，通常压出来的片剂难以符合薄膜包衣对素片的要求，因此，有必要通过制剂技术来解决可压性差的问题，来提高中药素片本身质量，从而使之符合薄膜包衣的要求。

卡波姆目前主要在凝胶剂基质和缓控制剂中作缓释材料。由于其具有良好的可压性及粘合性，因此，有望在改善中药片质量方面起到良好的作用。

### 卡波姆使用于外用制剂

卡波姆系列产品目前使用最为广泛，应用在乳液、膏霜、凝胶中。中性环境下卡波姆树脂体系是极好的凝胶基质，其外观晶莹、手感润滑，是非常适合用来制备霜剂或凝胶剂；同时，由于工艺简单、稳定性好且具有用后感觉舒适的特点，因此在局部给药中、特别是在皮肤及眼用凝胶剂中具有广泛应用。

### 皮肤用软膏剂及凝胶剂

用四种不同基质制备的酮洛芬软膏剂，测试发现药物从卡波姆凝胶剂中释放的最快，释药速度的大小顺序为：卡波姆凝胶>亲水性软膏>冷霜>白凡士林膏。四种软膏抑制小鼠爪子水肿的作用顺序同释药顺序，经皮内吸收与体外吸收，结果具有良好相关性。

### 卡波姆凝胶剂应用实例

卡波姆(聚羧乙烯)为高分子共聚物，在水中溶胀后可形成透明的半固体状物质。通过卡波姆在凝胶剂制备过程中的应用实例，总结该基质使用的经验和体会说明——卡波姆为一种制备优良凝胶剂的新辅料。

凝胶是包含液体的半固体胶冻和其干燥体系(干胶)的通称。它具有由胶粒粘合和交联而成的立体网状结构，所含液体分布在网状物间，液体可以是水、醇或其他有机溶剂，形成的凝胶有水凝胶、醇凝胶等名称。卡波姆为白色粉末状物质，易吸湿结块，可溶于水、乙醇和甘油。其 1%水溶液

的 pH 为 3.0, 可用碱中和。本品形成的水凝胶, 在 pH 为 6~12 时最为粘稠, 当  $\text{pH} < 3$  和  $> 12$  时, 粘度降低, 强电解质存在也会使粘度降低, 曝露于阳光下会迅速失去粘性, 加入抗氧化剂可使反应减慢。胶浆在 pH5~11 范围内十分稳定, 可高压蒸汽灭菌, 不分解, 粘度不变, 可加入适量的防腐抑菌剂。卡波姆水溶液除具有很好的粘和性及凝胶性外, 还具有良好的乳化性、增稠性、助悬性和成膜性。用于制备凝胶具有无毒、无刺激性、细腻滑爽感, 与皮肤耦合效果极佳。

## 1. 双氯芬酸二乙胺凝胶

### 1.1 处方

双氯芬酸二乙胺 1.0g, 丙二醇 10ml, 乙醇 20ml, 卡波姆 1.0g, 三乙醇胺 1.0~1.2g, 羟苯乙酯 0.1g, 水加至 100ml。

### 1.2 配制

将卡波姆洒于液面(60ml左右), 隔夜后成为凝胶剂基质, 静置后真空脱泡, 将三乙醇胺与其余药物混匀, 逐渐加入到浆料中混匀, 避免剧烈搅拌混入过多气泡。

### 1.3 用途

外涂于各种扭伤、关节痛、肌肉痛处, 一日不超过 20g。

### 1.4 制剂注释

由于卡波姆可溶于乙醇和丙二醇中, 因此两者既是溶剂, 同时又有促进透皮吸收的作用; 卡波姆浓度与凝胶稠度有关, 当大于 1.5%~2.0%时必须采用离心或减压方法脱泡处理。

以卡波姆作为凝胶剂的基质，具有水溶性基质的特点，要比其它基质药物释放速度快，吸收好。

## 2. 氧氟沙星凝胶

### 2.1 处方

氧氟沙星 1.0g, 氨水适量, 水 15ml, 丙二醇 10ml, 1.2%卡波姆基质加至 100g。

### 2.2 制备

取氧氟沙星及蒸馏水置于小烧杯内，滴加氨水至氧氟沙星完全溶解 (pH?8~9)，水浴加热除去多余的氨离子，加丙二醇及卡波姆基质至全量，搅匀即可。

### 2.3 用途

氧氟沙星为广谱抗菌药，用于各种感染性皮肤病。

### 2.4 制剂注解

① 氧氟沙星为两性化合物，即可溶于酸又可溶于碱，但在水中仅能溶解 0.2%左右。此外若加酸使氧氟沙星溶解，再加入基质中会使卡波姆沉淀出来，所以选用氨水或三乙醇胺来溶解氧氟沙星。加入基质后，制品的 pH 要求在 7~7.5，因氧氟沙星在此 pH 值下抗菌作用强；

② 以上处方还可以调整，如加入 0.5%盐酸利多卡因，可用于面积不大的烫伤治疗；由于此基质润滑且有一定的粘度，对粘膜无刺激，主药氧氟沙星为广谱抗菌剂，杀菌速度快，对性病病原菌作用强，将浓度调至 0.25~0.5%时可作为外用药预防性病。

### 3 . 甲硝唑凝胶

#### 3.1 处方

甲硝唑 0.75~1.0g, 丙二醇 20ml, 卡波姆基质加至 100ml。

#### 3.2 制备方法

将甲硝唑及丙二醇放入小烧杯内, 水浴加热, 加卡波姆基质至全量, 搅拌均匀后脱泡即可。

#### 3.3 用法用量

阴道用药每次 5g, bid, 连续使用 7 天。

#### 3.4 特点

该药使用后局部浓度高, 无不良反应; 如用卡波姆 943 作控释粘合剂制得的缓释制剂, 可获得稳定的持续释放, 使释放更加均匀, 生物利用度显著提高。

### 4 . 2%盐酸利多卡因凝胶

#### 4.1 处方

盐酸利多卡因 3.5 g, 卡波姆基质适量, 5%羟苯乙酯 1 ml, 蒸馏水加至 100 ml。

#### 4.2 用途

成品制成每瓶 20ml, 灭菌后备用, 可涂抹于各种检查器械上, 具有润滑、减少刺激的作用及不影响视野的特点, 如用于食管镜、气管镜、导尿管检查; 妇女作尿道检查时可用棉签蘸 3~7 ml 涂于局部; 也可用于尿道扩张术或膀胱镜检查, 用量每日不超过 600 mg。

## 5. 1%麻黄碱凝胶

### 5.1 处方

麻黄碱 10g, 冬绿油 0.1ml, 卡波姆 10g, 乙醇 20ml, 桉叶油 1.0ml, 水加至 960ml。

### 5.2 制备

将卡波姆加入水中, 隔夜后脱泡; 将麻黄碱溶于乙醇中, 加到基质中搅拌后逐渐透明, 加入其它成分及水至全量。

### 5.3 特点

该制剂由于形成麻黄碱卡波姆有机大分子盐, 在患处作用时间长。涂于鼻腔能使充血的粘膜血管收缩, 可治疗鼻炎、伤风鼻塞等症; 也可以在处方中加入呋喃西林或 1%利巴韦林达到抗菌消炎作用。

## 6. 绿药膏

盐酸林可霉素 5.0g, 盐酸利多卡因 4.0g, 依沙吖啶(利凡诺)0.2g, 苹果绿适量, 卡波姆基质加至 1000g。

## 7. 卡波姆在上述凝胶剂处方中的小结

7.1 卡波姆是弱酸性阴离子型辅料, 与一价碱成盐而变得透明, 遇二价碱析出沉淀, 与一些有机碱如麻黄碱也能成盐而透明。

7.2 卡波姆遇分子量较大的阳离子药物如盐酸氧氟沙星也会产生沉淀。

7.3 配制盐酸利多卡因时控制 pH 值在 6.0 左右, 是考虑到制品的稳



定性问题。

7.4 少量挥发油类或在基质中不溶的其它物质，可先用吐温 80 或增加处方中丙二醇、乙醇用量使之变得透明。

7.5 卡波姆基质遇高浓度乙醇也会析出沉淀。宜先配好基质(卡波姆在水中溶胀，再用碱中和后备用)，再加入其它药物操作比较方便。

7.6 用卡波姆配制的凝胶剂具有美观、易清洗、吸收快、使用方便等特点。

通过上述，我们可以清楚得了解到卡波姆树脂在药剂中有着广泛的应用，而且不断出现一些新的用途。最近几年，有关其研究的报道不断增多，国内也开始重视它的研究应用，我们可以乐观的预计到卡波姆将会成为药用辅料中的一个新的、重要的成员。

总之，卡波姆作为药用辅料和化妆品原料，有着广阔的应用前景。

我们北京国人逸康科技有限公司出品的不同型号的医药级卡波姆系列产品，其粘度准确、纯度高、残留量低，所有指标均达到或超过国家药典标准，并且部分指标达到了（USPNF20）标准。

我公司真诚的向您推荐卡波姆系列产品，并为您开发新的产品提供技术服务和售后支持。如果需要详细资料和技术服务请与我们技术部联系。

地 址：北京海淀区清河清缘东里澳洲新星 10 号楼 5-10

邮 编：100085

电 话： 010-5165098 62992114 (服务热线)

传 真： 010-62992481

网 址： [www.bjgryk.com](http://www.bjgryk.com) [www.8a88.cn](http://www.8a88.cn)

E—MAIL: [cbg911@163.com](mailto:cbg911@163.com)

北京国人逸康科技有限公司