



胶束介绍资料

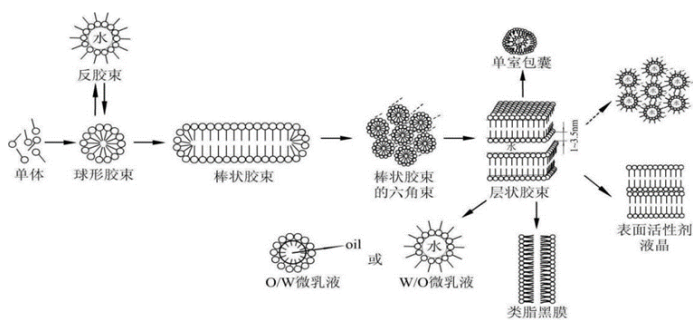
作者: Alpharmaca 编辑: Jason Wu

什么是胶束?

胶束是指表面活性剂溶于水, 当其浓度较低时呈单分子分散或被吸附在溶液的表面上而降低表面张力。当表面活性剂的浓度增加至溶液表面已经饱和而不能再次吸附时, 表面活性剂的分子即开始转入溶液内部, 由于表面活性剂分子的疏水部分与水的亲和力较小, 而亲水部分之间的吸引力较大, 当达到一定浓度时, 许多表面活性剂分子(一般50~150个)的疏水部分便相互吸引, 缔合在一起, 形成缔合体, 这种缔合体称为胶团或胶束, 胶团有各种形状, 如球形, 层状, 棒状。

胶束: 表面活性剂分子的亲脂尾端聚于胶束内部, 避免与极性的水分子接触; 分子的极性亲水头端则露于外部, 与极性的水分子发生作用, 并对胶束内部的憎水基团产生保护作用。形成胶束的化合物一般为两亲分子, 因此一般胶束除可溶于水等极性溶剂以外, 还能以反胶束的形式溶于非极性溶剂中。

胶束的形态有微球、囊泡状、棒状、层状、六角束状、洋葱状、蠕虫状等。根据胶束亲水-疏水嵌段长度的不同, 可将胶束分成两种, 若亲水断长度大于比疏水端, 形成星行胶束, 亲脂嵌段大于亲水嵌段则形成平台头胶束。如表1所示。



胶束的形成机理

嵌段共聚物胶束的形成取决于疏水端的吸引力和亲水端的排斥力。依据热力学定律, 核壳界面的表面自由能较少时胶束更稳定, 此时胶束收缩, 界面积缩小, 亲水端的空间排斥力增大; 界面张力和空间排斥力相互制约, 使胶束不能无限的聚集或舒张而形成具有稳定粒径的胶束体系。

影响胶束稳定的主要因素:

共聚物嵌段的结构和比例-当嵌段共聚物的疏水嵌段较长, 比例较大时, 有利于增容量;

共聚物的疏水嵌段的与药物的相容性;

溶剂-溶剂极性不同, 对各嵌段的作用不同, 其规律为亲水嵌段与溶剂的极性越近, 而疏水嵌段与溶剂的极性相差越远, 胶束的聚集越大, 越有利于增溶;

添加剂-依据亲水嵌段是否可离子化及离子化的程度, 添加剂引入的离子会改变亲水链段斥力, 使胶束的形态发生变化;

温度-通常在极性溶剂如水中, 升温促使胶束形成, 而在非极性溶剂中形成的反向胶束, 升温不利胶束形成。

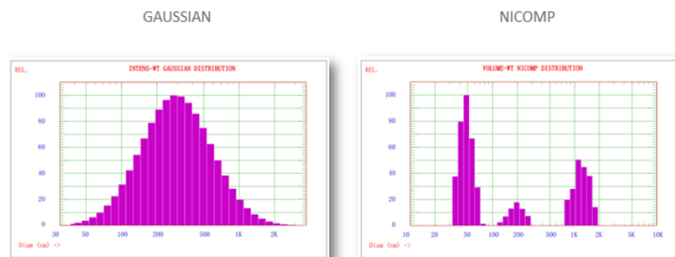
胶束的应用

胶束在抗肿瘤药物胶束、抗真菌药物胶束、抗炎药物胶束、透过血脑屏障、基因传递、放射、造影药物包封等药学领域具有很深的应用价值。

胶束的制作和粒度检测难点

胶束的形态各异, 亲水-疏水的嵌段长度各异, 搭载药物后胶束的稳定性以及相容性难以把控, 包括上述的影响因素的把控程度均为胶束类应用研究的难点。因此, 对于胶束制备工艺中的粒度检测有着很高的要求。不同应用的胶束对粒度大小的要求不同, 工艺研发过程中如何判断反应是否顺利完成, 目标产物中是否有产生其他粒径的副产物, 均是胶束类样品粒度检测难点。

对某一胶束进行粒度检测, 其Gaussian分布及Nicomp分布测试结果如图1所示。



对于大部分粒度仪而言, 进行粒度检测时仅给出高斯(Gaussian)单峰正态分布; 而胶束类样品本身易团聚, 易出现部分大粒子团聚物。PSS Nicomp 380系列产品可同时给出Gaussian分布及Nicomp分布测试结果。由表1可知, 左侧Gaussian测试结果显示此胶束样品平均粒径约300nm左右; 而切换至Nicomp多峰分布图(右图), 显示具有三个峰; 真实呈现出复杂多组分样品的真实情况。

