

药剂：药物制剂新技术 PDF转换可能丢失图片或格式，建议
阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E8_8D_AF_E5_89_82_EF_BC_9A_E8_c23_17192.htm

第三章 药物制剂新技术
第一节 包合技术 一、包合技术：指一种分子被包合嵌于另一种分子的空穴结构内，形成包合物的技术。主分子客分子能否稳形成及是否稳定：取决于主、客分子的立体结构和二者极性。包合物的稳定性：取决于两组分间的范德化力。是物理过程，不是化学过程。 二、包合材料：（一）、环糊精CD：
-CD水中溶解度最小，毒性很低。（二）、环糊精衍生物：
1、水溶性环糊精衍生物：甲基、羟丙基、葡萄糖衍生物。G-
-CD常用，使难溶性药物溶解度增大，促进药物吸收，还作注射剂包合材料。 2、疏水性环糊精衍生物：乙基-
-CD，降低水溶性药物的溶解性，达到缓释作用。 三、包合作用的特点： 1、药物与环糊精组成的包合作用：通常是单分子包合物， 2、摩尔比是1：1。 3、包合时对药物的要求：原子数大于5(稠环小于5)， 4、相对分子质量100—400， 5、溶解度小于10g/L， 6、熔点低于250。无机药物大多不宜用CD包合。 7、药物的极性与缔合作用影响包合作用： 4、包合作用具竞争性 四、常用包合技术： 1、饱和水溶液法（重结晶法、共沉淀法） 2、研磨法 3、冷冻干燥法 4、喷雾干燥法 第二节 固体分散技术 一、固体分散技术：是固体分散在固体中的新技术，通常是一种难溶性药物以分子，胶态、微晶或无定型状态，分散在另一种水溶性、或难溶性、肠溶性材料中呈固体分散体系。 二、载体材料：吸收速率取决于溶出速率，溶出速率取决于载体材料的特性。（一）、水溶

性载体材料：1、聚乙二醇PEG：4000、6000 2、聚维酮PVP 3、表面活性剂：Poloxamer188 4、有机酸类 5、糖类和醇类：半乳糖、甘露醇(二)、难溶性载体材料：1、纤维素类：EC 2、聚丙烯酸树酯类：Eudragit E、RL、RS 3、其他：胆固醇等(三)、肠溶性载体材料：1、纤维素类：CAP、HPMCP、CMEC(羧甲乙基纤维素) 2、聚丙烯酸树酯类 三、常用的固体分散技术：1、熔融法：关键是迅速冷却，适于对热稳定的药物。 2、溶剂法：共沉淀法，适于对热不稳定或易挥发的药物。 3、溶剂-熔融法：适于液态药物，只适于剂量小于50mg的药物。 4、溶剂-喷雾(冷冻)干燥法：适于易分解或氧化，对热不稳定的药物。 5、研磨法 四、固体分散体的类型：1、简单低共熔混合物：药物以微晶形式分散在载体中。 2、固态溶液：以分子状态分散 3、共沉淀物：非结晶型无定型物，又称玻璃态固熔体。 六、固体分散体的速效与缓释原理：(一)、速效原理：1、分散状态影响药物溶出速率：分子分散>无定型>微晶 2、载体材料对药物溶出的促进作用：可润湿性、高度分散性、对药物抑晶性(二)、缓释原理：采用疏水或脂质类载体材料具有缓释作用。 100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com