

药剂学重点总结(十四) 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_E5_AD_A6_E9_c23_17503.htm

第14章 靶向制剂 一、

靶向制剂的概念与分类 1、靶向制剂的概念：亦称靶向给药系统（Targeting drug delivery system, TDDS），是通过载体使药物选择性地浓集于病变部位的给药系统。

1) 成功的靶向制剂应具备四个要素： 定位： 浓集： 控释： 无毒可生物降解。

2) 靶向制剂的特点： 可以提高药效： 降低毒性： 可以提高药品的安全性、有效性、可*性和病人用药的顺应性。

3)、按药物所到达的靶部位可将靶向制剂分为三类：（1）第一类是可以到达特定靶组织或靶器官的靶向制剂。

（2）第二类是可以到达特定靶细胞的靶向制剂。（3）第三类是可以到达细胞内某些特定靶点的靶向制剂。

目前通常的分类方法：被动靶向制剂：被动靶向制剂即自然靶向制剂，是进入体内的载药微粒被巨噬细胞作为外来异物所吞噬而实现靶向制剂，药物选择性地浓集于病变部位而产生特定的体内分布特征。靶向制剂常采用液晶、液膜、脂质、类脂质、蛋白质、生物降解型高分子物质作为载体材料。

.主动靶向制剂：一般是将微粒表面加以修饰后作为“导弹”性载体，将药物定向地运送到并浓集于预期的靶部位发挥药效的靶向制剂，即微粒表面特定的配体与靶细胞的受体结合。

物理化学靶向制剂：是用某些物理方法或化学方法使靶向制剂在特定部位发挥药效的靶向制剂。磁性微球制剂：载药微粒中加入磁性材料制成。

热敏感靶向制剂：加入对温度较为敏感的载体材料制备。pH敏感靶向制剂：使用对pH

敏感的载体材料制备，使其在体内特定pH的靶区释放药物。

栓塞性微球制剂：阻断靶区的血液供应，又在靶区释放药物，从而起到栓塞和靶向化疗的双重作用。

二、被动靶向制剂

1、脂质体系指将药物包封于类脂质双分子层内而形成的微型泡囊脂质体为类脂小球或液晶微囊。

1) 脂质体的组成与结构：(1) 脂质体的组成：是以磷脂为主要膜材并加入胆固醇等附加剂组成的板状双分子层或球状双分子层。(2) 脂质体的两个重要理化性质 相变温度：由“胶晶”态变为“液晶”态，在相变温度时，膜的流动性增加，被包裹在脂质体内的药物具有最大的释放速率。 荷电性：含酸性脂质的脂质体荷负电：含碱性脂质的脂质体荷正电：不含离子的脂质体显电中性。脂质体的表面荷与其包封率、稳定性、靶器官分布及靶细胞的作用有重要关系。(3) 脂质体的特点：

靶向性：脂质体进入体内可被巨噬细胞作为异物吞噬，浓集在肝、脾、淋巴系统等巨噬细胞丰富的组织器官中，因而可作为抗癌药物的载体。

靶向性：将药物包封成脂质体后，可使药物在体内缓慢释放。

组织相容性与细胞亲和性：脂质体本身是类似生物膜结构的泡囊，因而具有组织相容性。易与细胞融合，通过融合方式进入细胞内，经溶酶体消化后使药物释放于细胞内。

降低药物毒性：脂质体注射给药后，改变了药物的体内分布，主要在肝、脾、骨髓等单核-巨噬细胞较丰富的器官浓集，这种体内分布的改变必然减少心脏、肾脏和其他正常组织细胞中的药物浓度，可明显降低其心、肾毒性。这也是脂质体用于抗癌药物的载体的主要优点之一。

提高药物稳定性：脂质体双层膜的保护可使易被胃酸、胃酶破坏的药物稳定性及口服吸收的效果。(4) 制备脂质

体的材料 磷脂类：天然的卵磷脂、脑磷脂、豆磷脂以及合成磷脂。 胆固醇：胆固醇具有调节膜流动性的作用。（5）.脂质体的制备方法： 注入法 薄膜分散法 超声波分散法 逆相蒸发法 冷冻干燥法。（6）脂质体的作用机制和给药途径 脂质体与细胞的相互作用：作用过程可分为吸附、脂交换、内吞、融合四个阶段。 给药途径 脂质体适用于多种给药途径：静脉注射：肌肉与皮下注射：口服给药：眼部给药：肺部给药：经皮给药：鼻腔给药：2、靶向乳剂1）、乳剂的靶向性特点：对淋巴系统有较好的亲和性。油状或亲脂性药物制成O/W型乳剂静注后，药物可在肝、脾等巨噬细胞丰富的组织器官中浓集。水溶性药物制W/O型乳剂经口服、肌肉或皮下注射后，易聚集于淋巴器官、浓集于淋巴系统。 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