

药剂学重点总结(十二) 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_17508.htm

第12章 缓（控）释制剂
重点内容 1．缓(控)释制剂的概念和特点2．缓(控)释制剂释药原理及方法3．缓(控)释制剂的处方设计和体内外评价方法
次重点内容缓(控)释制剂的处方和制备工艺(了解) 考点摘要
缓释制剂：系指在用药后能在较长时间内持续释放药物以达到延长药效目的白勺制剂。控释制剂：系指药物能在设定的时间内自动地以设定的速度释放的制剂。二、缓控释制剂的区别
缓释制剂：口服药物在规定溶剂中，按要求缓慢地非恒速释放药物。控释制剂：口服药物在规定溶剂中，按要求缓慢地恒速或接近恒速释放药物。
一、概述 缓（控）释制剂的主要特点是：【掌】
优点： 减少给药次数，方便使用，提高病人的服药顺应性： 血药浓度平稳，避免或减小峰谷现象，有利于降低药物的毒副作用： 减少用药的总剂量，可用最小剂量达到最大药效。缺点： 缓（控）释制剂的设计基于健康人群的药物动力学数据，临床上难以灵活调节给药方案： 产品成本较高，价格较贵。
二、缓（控）释制剂的处方设计【掌】
1、影响口服缓（控）释制剂设计的因素
1) .理化因素
1. 剂量大小：常规口服制剂的单剂量最大剂量一般是0.5~1.0g，这也同样适用于缓（控）释制剂。对于治疗指数窄的药物还必须考虑服用剂量太大可能会产生安全问题。
2. pka、解离度和水溶性：胃肠道pH和药物的pka影响药物的解离程度，故胃肠道 pH对药物释放及吸收有影响。对于溶解度很小的药物（ 0.01mg/ml ），其在胃肠道中的吸收速度

受溶出速度的限制。设计缓（控）释制剂对药物溶解度的要求文献报道下限为0.1mg/ml。

3. 分配系数：分配系数小的药物透过膜较困难，通常生物利用度较差。

4. 稳定性：口服药物在胃肠道应稳定。

生物因素

1. 生物半衰期：一般半衰期短于1小时的药物制成缓（控）释制剂较为困难。
2. 吸收：药物在胃肠道中释放过慢，则药物未全部释放，制剂已离开吸收部位，故吸收速度常数很低的药物，不太适宜制备成缓（控）释制剂：局限于小肠的某一特定部位吸收，则制成缓（控）释制剂不利于药物的吸收。
3. 代谢：在肠道内吸收前有代谢作用的药物，制成缓（控）释制剂，生物利用度会有所降低。

1. 药物的选择 药效很剧烈以及溶解吸收很差的药物、剂量需要精密调节的药物，一般不宜制成缓（控）释制剂。

抗生素类药物，由于其抗菌效果依赖于血药峰浓度，一般不宜制成缓（控）释制剂。

适于制备缓（控）释制剂的药物有：抗心律失常药、抗心绞痛药、降压药、抗组织胺药、支气管扩张药、抗哮喘药、解热镇痛药、抗精神失常药、抗溃疡药、铁盐、氯化钾等。

3) 设计要求

- (1) 生物利用度：缓（控）释制剂的相对生物利用度应为普通制剂的80%~120%。若药物主要在胃和小肠吸收，宜设计成12小时口服一次，若药物在大肠也有一定吸收，则可考虑24小时口服一次。
- (2) 峰浓度与谷浓度之比缓（控）释制剂稳态时的峰浓度与谷浓度之比应小于或等于普通制剂。若设计成零级释放剂型如渗透泵，其峰谷浓度比应显著小于普通制剂。

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