

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