

药剂学笔记：缓释、控释制剂 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_E7_c23_17599.htm 缓释制剂：指有药后能在较长时间内持续释放药物以达到延长药效的目的的制剂。

一级控释制剂：指药物能在设定的时间内自动以设定速度释放，使血药浓度长时间恒定地维持在有效浓度范围内的制剂。包括控制释药的速度、方向、时间，靶向，透皮制剂都是。零级缓释、控释制剂释药原理和方法

一、溶出原理：减少药物溶解度，降低药物的溶出速率。

- 1、制成溶解度小的盐或酯
- 2、与高分子化合物生成难溶性盐
- 3、控制粒子大小
- 4、将药物包藏于溶蚀性骨架中

来源：考试大

- 5、将药物包藏于亲水性高分子骨架中

二、扩散原理：药物释放以扩散作用为主有以下几种：

- 1、水不溶性骨架片
- 2、溶性膜材包衣的制剂
- 3、零级释放
- 4、包衣膜中含有部分水溶性聚合物

来源：考试大

- 5、接近零级
- 6、水不溶性骨架片：符合Higuchi方程

缓释控释方法：

- 1、增加粘度
- 2、包衣
- 3、制成微囊
- 4、制成不溶性骨架片剂
- 5、制成植入剂
- 6、制成药树脂
- 7、制成乳剂

三、溶蚀与扩散、溶出结合

四、渗透压原理：渗透泵型片剂的释药速率与PH无关，在胃中与在肠中的释药速率相等。接近零级

五、离子交换作用

缓释、控释制剂的设计

一、影响口服缓释、控释制剂设计的因素：

(一)、理化性质：

- 1、剂量：一般0.5-1.0g
- 2、Pka、解离度和水溶性
- 3、分配系数
- 4、稳定性

(二)、生物因素：

- 1、生物半衰期：1-12h
- 2、吸收
- 3、代谢

二、缓释、控释制剂的设计：来源：考试大

(一)、药物的选择：2-8h为宜

(二)、设计要求：

- 1、生物利用度：胃与小肠 12h，

大肠24h 2、峰浓度与谷浓度 (三)、缓控释剂辅料：阻滞剂、骨架材料、增粘剂 缓释、控释制剂的处方和制备工艺 一、骨架型缓、控释制剂：(一)、骨架片的处方与工艺：1、凝胶骨架片 2、蜡质类骨架片 3、不溶性骨架片 (二)、缓、控释颗粒(微囊)压制片 来源：考试大 (三)、胃内滞留片 (四)、生物粘附片 来源：考试大 (五)、骨架型小丸 二、膜控型缓释、控释制剂：1、微孔膜包衣片 2、膜控释小片 3、肠溶膜控释片 4、膜控释小丸 来源：考试大 三、渗透泵片：由药物、半透膜材料、渗透压活性物质和推动剂组成。 四、植入剂 第五节 缓释、控释制剂体内、体外评价 一、体外释放度试验：1、溶出度试验 2、释放度试验 二、体内生物利用度研究 来源：考试大 三个取样点：第一个：0.5-2.h，30%以下，有无突释；第二个：4-6h，50% 第三个：7-10h 75% 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